



República Federativa do Brasil
Ministério da Indústria, Comércio Exterior
e Serviços
Instituto Nacional da Propriedade Industrial

(11) PI 0813863-0 B1

(22) Data do Depósito: 31/07/2008

(45) Data de Concessão: 27/09/2016



(54) Título: DERIVADO DE OXOPIRAZINA OU UM SAL AGROQUIMICAMENTE ACEITÁVEL DO MESMO, HERBICIDA, E, MÉTODO PARA USAR UM HERBICIDA

(51) Int.Cl.: C07D 241/44; A01N 43/60; A01N 43/653; A01N 43/66; A01N 43/80; A01N 43/84; A01N 43/90; A01N 47/02; A01P 13/00; C07D 471/04

(30) Prioridade Unionista: 01/08/2007 JP 2007-201387

(73) Titular(es): KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.. IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.

(72) Inventor(es): RYUJI TAMAI, MINORU ITO, MASAMI KOBAYASHI, TAKASHI MITSUNARI, YUKI NAKANO

“DERIVADO DE OXOPIRAZINA OU UM SAL AGROQUIMICAMENTE ACEITÁVEL DO MESMO, HERBICIDA, E, MÉTODO PARA USAR UM HERBICIDA”

CAMPO TÉCNICO

5 A presente invenção diz respeito a um derivado de oxopirazina inédito ou um sal do mesmo, um herbicida contendo o mesmo como um ingrediente ativo, e um método para usar o mesmo.

FUNDAMENTOS DA TECNOLOGIA

Vários compostos entre os derivados de 1,3-cicloexanodiona
10 que foram acilados na posição 2 com um grupo arilcarbonila, já são comercialmente disponíveis como produtos agroquímicos. Por exemplo, mesotriona atrai atenção pública como um herbicida aplicado nas folhas de milho tendo um novo mecanismo de ação. Uma 1,3-cicloexanodiona é um tautômero, que existe também como 1-hidroxícicloexeno-3-ona que é uma
15 forma de enol deste, e este derivado foi desenvolvido como um composto para vários usos agroquímicos.

Por exemplo, um derivado tendo o grupo arila do grupo arilcarbonila substituindo na posição 2 alterando para vários grupos heteroarila ou cicloalquila, tal como pirazina (ver documento patente 1), um
20 derivado tendo o anel de 1,3-cicloexanodiona fundido nas posições 4 e 5 com um anel de ciclopropano (ver documento patente 2), um derivado tendo o grupo arilcarbonila na posição 2 alterado para um derivado do grupo pirimidin-5-ilcarbonila (ver documento patente 3), um derivado tendo o grupo arilcarbonila na posição 2 alterado para um derivado do grupo pirazin-2-
25 ilcarbonil (ver documento patente 4), um derivado tendo o grupo arilcarbonila na posição 2 alterado para um derivado do grupo 1,2,3-tiadiazol-5-ilcarbonila (ver documento patente 5), derivados tendo o grupo arilcarbonila na posição 2 alterado para um derivado do grupo piridinacarbonila (ver documento patentes 2, 6, 7, 8, 9 e 10), derivados tendo o grupo arilcarbonila na posição 2.

alterado para um derivado do grupo quinolinacarbonila (ver documento patentes 11 e 12), um derivado tendo o grupo arilcarbonila na posição 2 alterado para um grupo heteroarilcarbonila formado de um benzazol (ver documento patente 13), um derivado tendo o grupo arilcarbonila na posição 2
5 alterado para um derivado do grupo azolcarbonil formado de um 1,2-azol (ver documento patente 14), e similares foram reportados. Além disso, derivados em que a posição 4 e a posição 6 do anel de 1,3-cicloexanodiona são reticulados por um grupo alquilenos, tal como um grupo etileno, também foram reportados (ver documento patentes 8, 11, 12, 13, 14, 15 e 16). Além
10 do mais, também foi reportado ter um anel de 3,5-cicloexanodiona-1-tiona em que a posição 5 do anel de 1,3-cicloexanodiona foi alterado para um grupo oxo, e a posição 1 foi alterada para um grupo tiocarbonila (ver documento patente 17).

Como tal, um grande número de compostos de
15 cicloexanodiona tendo atividade herbicida foram reportados, mas não existe nenhum composto de cicloexanodiona conhecido tendo um anel de diidropirazina substituído por um grupo oxo ou um grupo tioxo (no presente pedido de patente, estes podem ser genericamente denominados (tio)oxo), tal como o composto da presente invenção representado pela seguinte fórmula
20 [I].

Documento patente 1: EP-283261

Documento patente 2: WO 91/00260

Documento patente 3: US 4708732

Documento patente 4: DE-3902818

25 Documento patente 5: EP-338525

Documento patente 6: JP-A No. 2-78662

Documento patente 7: JP-A No. 3-52862

Documento patente 8: JP-A No. 4-29973

Documento patente 9: WO 96/14285

Documento patente 10: WO 2000/39094

Documento patente 11: JP-A No. 2000-16982

Documento patente 12: WO 2000/14069

Documento patente 13: WO 2000/68210

5 Documento patente 14: JP-A No. 2005-200401

Documento patente 15: WO 2005/058831

Documento patente 16: WO 2006/066871

Documento patente 17: DE 10256354

DESCRIÇÃO DA INVENÇÃO

10 PROBLEMAS A SER RESOLVIDOS PELA INVENÇÃO

Conforme discutido anteriormente, compostos de 1,3-cicloexanodiona substituídos por um grupo heteroarilcarbonila específico são conhecidos por ter uma atividade herbicida, mas uma vez que estes compostos precisam ser aplicados em altas doses, eles não são satisfatórios como herbicidas. Assim, existe uma demanda para o desenvolvimento de um herbicida que mostra excelentes propriedades em doses menores.

A presente invenção foi alcançada em tais circunstâncias, e um objetivo da presente invenção é fornecer um composto tendo uma atividade herbicida que não tem nenhum dano induzido por medicamento contra plantas úteis e lavouras úteis, e podem controlar várias ervas daninhas que crescem em campos não plantados, pomares, campos de arroz e terras não agrícolas em baixas doses, e um herbicida contendo o composto.

MEIOS PARA RESOLVER O PROBLEMA

De maneira a alcançar o propósito descrito anteriormente, os inventores da presente invenção devotadamente conduziram pesquisa na estrutura química e atividade herbicida dos compostos de cicloexanodiona.

Como um resultado, eles observaram que um composto de cicloexanodiona tendo um anel de pirazina substituído por um grupo oxo ou um grupo tioxo pode controlar várias ervas daninhas que crescem em campos

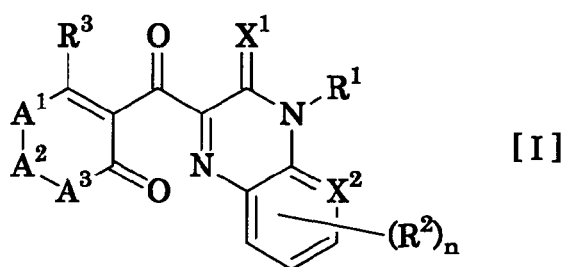
não plantados, pomares, campos de arroz e terras não agrícolas por um longo tempo, e apresenta alta segurança contra plantas úteis, lavouras úteis e similares, assim completando a presente invenção.

Assim, a presente invenção é caracterizada no fato de que um composto de 2-heteroarilcarbonil-1,3- cicloexanodiona tendo uma atividade herbicida, um grupo 2-(tio)oxopirazin-3-ila que pode ser substituído, e preferivelmente um grupo 2-(tio)oxobenzopirazin-3-ila que pode ser substituído ou um grupo 2-(tio)oxopiridopirazina-3-ila que pode ser substituído, é usado como o grupo heteroarila.

Mais especificamente, a presente invenção diz respeito aos seguintes (1) a (7).

(1) Um derivado de oxopirazina representado pela fórmula [I], ou um sal agroquimicamente aceitável do mesmo:

[Fórmula química 1]



em que X¹ representa um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre;

X² representa CH (o átomo de carbono pode ser substituído por R²), isto é, CH que pode ser substituído por um substituinte R², ou N(O)_m;

m representa um número inteiro de 0 ou 1;

R¹ representa um átomo de hidrogênio; um grupo alquila C₁-C₁₂; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo cicloalquil C₃-C₈ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo haloalquenila C₂-C₆; um grupo haloalquinila C₂-C₆; um grupo halocicloalquila C₃-C₈; um grupo halocicloalquil C₃-C₈ alquila C₁-C₆; um grupo aminoalquila C₁-C₆; um grupo nitroalquila C₁-C₆; um grupo

mono(alquil C₁-C₆) aminoalquila C₁-C₆; um grupo di(alquil C₁-C₆) aminoalquila C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfinil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo hidroxialquila C₁-C₆; um grupo fenilalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆ (a fração fenila do grupo pode ser substituída por um ou dois ou mais R⁴ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenilalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆ em que o grupo fenila pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁴ idênticos ou diferentes; um grupo alcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cicloalquilóxi C₃-C₈ alquila C₁-C₆; um grupo cicloalquil C₃-C₈ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo fenilóxi alquila C₁-C₆ (a fração fenila do grupo pode ser substituída por um ou dois ou mais R⁴ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenilóxi alquila C₁-C₆ em que o grupo fenila pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁴ idênticos ou diferentes; um grupo heterocíclico alquilóxi C₁-C₆ em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e tendo 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio no grupo, pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁵ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo heterocíclico alquilóxi C₁-C₆ em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁵ idênticos ou diferentes; um grupo feniltop C₁-C₆ (a fração fenila do grupo pode ser substituída por um ou dois ou mais R⁴ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenilto C₁-C₆ em que o grupo fenila pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁴ idênticos ou diferentes; um grupo fenilsulfinil alquila C₁-C₆

(um fenila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^4 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenila pode ser substituído por um ou dois ou mais R^4 idênticos ou diferentes; um grupo fenilsulfonilalquila C_1-C_6 (um fenila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^4 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenila pode ser substituído por um ou dois ou mais R^4 idênticos ou diferentes; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo heterocíclico alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e tendo 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio no grupo, pode ser substituído por um ou dois ou mais R^5 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo heterocíclico alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e pode ser substituído por um ou dois ou mais R^5 idênticos ou diferentes; um grupo alquiltio C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfinil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalquila C_1-C_6 ; um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo acil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo acilamino C_1-C_6 ; um grupo di(alcóxi C_1-C_6) alquila C_1-C_6 ; um grupo alcoxicarbonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcoxiiimino C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilidenoaminóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo $(R^6R^7N-C=O)$ alquila C_1-C_6 ; um grupo aril C_6-C_{10} alquila C_1-C_6 (a fração arila do grupo pode ser substituída por um ou dois ou mais R^8 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo aril C_6-C_{10} alquila C_1-C_6 em que o grupo arila pode ser substituído por um ou dois ou mais R^8 idênticos ou diferentes; um grupo alquila C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo

de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio no grupo, pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo alquila C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes; um grupo $NR^{10}R^{11}$; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo arila C_6-C_{10} (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{12} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo arila C_6-C_{10} que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{12} idênticos ou diferentes; ou um grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{13} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo heterocíclico que tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{13} idênticos ou diferentes;

R^2 representa um átomo de halogênio; um grupo hidroxila; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo cicloalquil C_3-C_8 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquenila C_2-C_6 ; um grupo haloalquinila C_2-C_6 ; um grupo halocicloalquila C_3-C_8 ; um grupo halocicloalquil C_3-C_8 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo cicloalquilóxi C_3-C_8 ; um grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilóxi C_1-C_6 ; um grupo alquenilóxi C_2-C_6 ; um grupo alquinilóxi C_2-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfinila

C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo amino; um grupo mono(alquil C_1-C_6) amino; um grupo di(alquil C_1-C_6) amino; um grupo acilamino C_1-C_6 ; um grupo hidroxialquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfinil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfinil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalquila C_1-C_6 ; um grupo acila C_1-C_6 ; um grupo alcóxiimino C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo carboxila; um grupo alcóxicarbonila C_1-C_6 ; um grupo carbamoila; um grupo mono(alquil C_1-C_6) aminocarbonila; um grupo di(alquil C_1-C_6) aminocarbonila; ou um grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio no grupo, pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes; e além disso, dois R^2 adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais R^2 são diretamente ligados, para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e o anel assim formado pode ser substituído por um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ou um grupo oxo;

n representa um número inteiro de 0 a 4 quando X^2 é CH (o grupo pode ser substituído por R^2), isto é, quando X^2 é CH que pode ser substituído por um substituinte R^2 , e n representa um número inteiro de 0 a 3 quando X^2 é $N(O)_m$;

- 5 R^3 representa um grupo hidroxila; O-M⁺ (em que M⁺ é um cátion de metal alcalino ou um cátion amônio); um grupo amino; um átomo de halogênio; um grupo alquilsulfonilóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfinila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆; um grupo alqueniltio C₂-C₆; um grupo alquenilsulfinil C₂-C₆; um grupo alquenilsulfonil C₂-C₆; um grupo alquiniltio C₂-C₆; um grupo alquinilsulfinila C₂-C₆; um grupo alquinilsulfonila C₂-C₆; um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆; um grupo alquenilcarbonilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilcarbonilóxi C₂-C₆; um grupo fenóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenóxi que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes; um grupo feniltio (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo feniltio que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes; um grupo fenilsulfinila (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenilsulfinila que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes; um grupo fenilsulfonila (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenilsulfonila que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes; um grupo fenilsulfonilóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenilsulfonilóxi que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes; um grupo fenilcarbonilóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14}

idênticos ou diferentes), isto é, um grupo fenilcarbonilóxi que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes; um grupo 1,2,4-triazol-1-ila; um grupo 1,2,3-triazol-1-ila; um grupo 1,2,3-triazol-2-ila; grupo um imidazol-1-ila; um grupo pirazol-1-ila; um grupo tetrazol-1-ila; ou
 5 um grupo tetrazol-2-ila;

R^4 representa um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquenilóxi C_2-C_6 ; um grupo alquinilóxi C_2-C_6 ;
 10 um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfinila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfinila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ;

R^5 representa um grupo oxo; um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquenilóxi C_2-C_6 ; um grupo alquinilóxi C_2-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ;
 20 C_6 ; um grupo alquilsulfinila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfinila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ;

R^6 e R^7 cada um independentemente representa um grupo alquila C_1-C_6 , e além disso, R^6 e R^7 podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual estes são ligados para formar um anel de 5 a 6 membros, enquanto que o anel assim formado pode ter um átomo de oxigênio interposto, além do átomo de nitrogênio ao qual R^6 e R^7 são ligados;

R^8 representa um átomo de halogênio; um grupo nitro; um

grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo alquenilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilóxi C₂-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfinila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆; um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆; um grupo acila C₁-C₆; ou um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆;

R⁹ representa um grupo oxo; um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo alquenilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilóxi C₂-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfinila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆; um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆; um grupo acila C₁-C₆; ou um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆;

R¹⁰ e R¹¹ cada um independentemente representa um átomo de hidrogênio; um grupo alquila C₁-C₆; ou um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆, e além disso, R¹⁰ e R¹¹ podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual estes são ligados para formar um anel de 5 a 6 membros, enquanto que o anel assim formado pode ter um átomo de enxofre e/ou um átomo de oxigênio interposto, além do átomo de nitrogênio ao qual R¹⁰ e R¹¹ são ligados;

R¹² representa um átomo de halogênio; um grupo hidroxila; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo cicloalquil C₃-C₈ alquila C₁-C₆; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo haloalquenila C₂-C₆; um grupo halocicloalquila C₃-C₈; um grupo halocicloalquil C₃-C₈ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo

cicloalquilóxi C₃-C₈; um grupo alquenilóxi C₂-C₆; um grupo alquilnilóxi C₂-C₆; um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfinila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆; um grupo amino; um grupo acilamino C₁-C₆; um grupo mono(alquil C₁-C₆) amino; um grupo di(alquil C₁-C₆) amino; um grupo hidroxialquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfinil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cianoalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆; um grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilóxi C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆; um grupo cianoalcóxi C₁-C₆; um grupo acila C₁-C₆; um grupo alcoxiimino C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo carboxila; um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆; um grupo carbamoíla; um grupo mono(alquil C₁-C₆) aminocarbonila; um grupo di(alquil C₁-C₆) aminocarbonila; um grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo heterocíclico que tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ idênticos ou diferentes; ou um grupo alcóxi C₁-C₆ heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e tendo 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio no grupo, pode ser substituído por um ou dois ou

mais R^{14} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo alcóxi C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes, ou dois R^{12} adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais R^{12} são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, enquanto que o anel assim formado pode ser substituído por um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ou um grupo oxo;

R^{13} representa um grupo oxo; um grupo tioxo; um grupo hidroxila; um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo cicloalquil C_3-C_8 alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquenila C_2-C_6 ; um grupo halocicloalquila C_3-C_8 ; um grupo halocicloalquil C_3-C_8 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquenilóxi C_2-C_6 ; um grupo alquinilóxi C_2-C_6 ; um grupo cicloalquilóxi C_3-C_8 ; um grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilóxi C_1-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 ; um grupo cianoalcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfinila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfinila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo amino; um grupo mono(alquil C_1-C_6) amino; um grupo di(alquil C_1-C_6) amino; um grupo acilamino C_1-C_6 ; um grupo carboxila; um grupo alcoxicarbonila C_1-C_6 ; um grupo carbamoíla; um grupo mono(alquil C_1-C_6) aminocarbonila; um grupo di(alquil C_1-C_6) aminocarbonila; um grupo acila

C₁-C₆; um C₁-C₆ grupo alcoxiimino alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfinil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; ou um grupo cianoalquila C₁-C₆; e ainda, dois R¹³ adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais R¹³ são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, enquanto que o anel assim formado pode ser substituído por um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo alquila C₁-C₆, um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo haloalcóxi C₁-C₆ ou um grupo oxo;

R¹⁴ representa um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo haloalcóxi C₁-C₆;

A¹ representa C(R¹⁵R¹⁶);

A² representa C(R¹⁷R¹⁸), ou C=O;

A³ representa C(R¹⁹R²⁰); e

R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ e R²⁰ cada um independentemente representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁-C₆, e R¹⁵ e R²⁰ podem ser unidos juntos para formar uma cadeia de alquilenos C₂-C₅, e pode constituir um anel junto com átomos de carbono adjacentes.

(2) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com (1) anterior, em que na fórmula [I], X² é CH (o grupo pode ser substituído por R²), isto é, CH que pode ser substituído por um substituinte R².

(3) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com (1) anterior, em que na fórmula [I], X² é

$N(O)_m$.

(4) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com a reivindicação 1, em que na fórmula [I], R^3 é grupo hidroxila; ou $O-M^+$ (em que M^+ é um cátion de metal alcalino ou um cátion amônio).

(5) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com (1) anterior, em que na fórmula [I],

X^1 é um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre;

X^2 é CH (o átomo de carbono pode ser substituído por R^2), isto é, CH que pode ser substituído por um substituinte R^2 , ou um átomo de nitrogênio;

R^1 representa um átomo de hidrogênio; um grupo alquila C_1-C_{12} ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquenila C_2-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo fenóxi alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo tetraidrofurano alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalquila C_1-C_6 ; um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo acil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcoxycarbonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo $(R^6R^7N-C=O)$ alquila C_1-C_6 ; um grupo aril C_6-C_{10} alquila C_1-C_6 (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^8 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo aril C_6-C_{10} alquila C_1-C_6 em que o grupo arila pode ser substituído por um ou dois ou mais R^8 idênticos ou diferentes; um grupo Het^1 -alquila C_1-C_6 (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het^1 -alquila C_1-C_6 que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes; um grupo $NR^{10}R^{11}$; um grupo

arila C₆-C₁₀ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes), isto é, um grupo arila C₆-C₁₀ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes; ou um grupo Het¹ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het¹ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes, em que Het¹ é tetraidrofurano, tetraidrotiofeno, dióxido de tetraidrotiofeno, tetraidrotiopirano, dióxido de tetraidrotiopirano, 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-diidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano ou indol;

R² é um átomo de halogênio, um grupo nitro, um grupo alquila C₁-C₆, um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo alquiltio C₁-C₆, um grupo alquilsulfonila C₁-C₆, ou um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆;

n representa um número inteiro de 0 a 4 quando X² é CH (o grupo pode ser substituído por R²), isto é, CH que pode ser substituído por R², e quando X² é N(O)_m, n representa um número inteiro de 0 a 3;

R³ é um grupo hidroxila;

R⁶ e R⁷ cada um independentemente representa um grupo alquila C₁-C₆;

ou R⁶ e R⁷ também podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados para formar um anel de 5 a 6 membros, enquanto que este anel pode ter um átomo de oxigênio interposto, além do átomo de nitrogênio ao qual R⁶ e R⁷ são ligados;

R⁸ é um átomo de halogênio, um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, ou um grupo haloalcóxi C₁-C₆;

R⁹ é um grupo alquila C₁-C₆, um átomo de halogênio, ou um grupo haloalquila C₁-C₆;

R^{10} e R^{11} são cada um independentemente um grupo alquila C_1-C_6 , ou um grupo alcóxicarbonila C_1-C_6 ;

R^{12} é um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo cicloalquila C_3-C_8 ,
 5 um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo alquenilóxi C_2-C_6 , um grupo alquinilóxi C_2-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 , um grupo alquiltio C_1-C_6 , um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 , um grupo haloalquiltio C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 , um grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilóxi C_1-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 , um grupo cianoalcóxi C_1-C_6 ,
 10 um grupo acila C_1-C_6 , um grupo alcóxicarbonila C_1-C_6 , um grupo di(alquil C_1-C_6) amino, ou um grupo Het^1 alcóxi C_1-C_6 (Het^1 tem o mesmo significado definido anteriormente), ou dois R^{12} adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais eles são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros ou um anel heterocíclico de 4
 15 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, enquanto que o anel assim formado pode ser substituído por um átomo de halogênio, um grupo alquila C_1-C_6 ou um grupo oxo; e

R^{13} é um grupo oxo, um átomo de halogênio, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , ou um grupo
 20 mono(alquil C_1-C_6) amino.

(6) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com qualquer um de (1), (2), (4) e (5) anterior, em que na fórmula [I],

25 X^1 representa um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre;
 X^2 é CH (o grupo pode ser substituído por R^2), isto é, CH que pode ser substituído por um substituinte R^2 ;

R^1 é um átomo de hidrogênio; um grupo alquila C_1-C_{12} ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-

C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo fenóxi alquila C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo tetraidrofurano alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cianoalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cianoalquila C₁-C₆; um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo acil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcoxicarbonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquila C₁-C₆; um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁸ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ em que o grupo arila pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁸ idênticos ou diferentes; um grupo Het¹-alquila C₁-C₆ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁹ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het¹-alquila C₁-C₆ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁹ idênticos ou diferentes; um grupo NR¹⁰R¹¹; um grupo arila C₆-C₁₀ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes), isto é, um grupo arila C₆-C₁₀ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes; ou um grupo Het¹ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het¹ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes, em que Het¹ é tetraidrofurano, tetraidrotiofeno, dióxido de tetraidrotiofeno, tetraidrotiopirano, dióxido de tetraidrotiopirano, 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-diidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano ou indol;

R² é um átomo de halogênio, um grupo nitro, um grupo alquila C₁-C₆, um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo alquiltio C₁-C₆, um grupo alquilsulfonila C₁-C₆ ou um grupo alcóxi C₁-C₆

alquila C₁-C₆;

n é um número inteiro de 0 a 4;

R³ é um grupo hidroxila;

5 R⁶ e R⁷ cada um independentemente representa um grupo alquila C₁-C₆, ou R⁶ e R⁷ podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados para formar um anel de 5 a 6 membros, enquanto que o anel assim formado pode ter um átomo de oxigênio interposto, além do átomo de nitrogênio ao qual R⁶ e R⁷ são ligados;

R⁸ é um átomo de halogênio ou um grupo alcóxi C₁-C₆;

10 R⁹ é um grupo alquila C₁-C₆;

R¹⁰ e R¹¹ são cada um independentemente um grupo alquila C₁-C₆, ou um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆;

R¹² é um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo alquila C₁-C₆, um grupo cicloalquila C₃-C₈,
 15 um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo alquêníloxi C₂-C₆, um grupo alquíníloxi C₂-C₆, um grupo haloalcóxi C₁-C₆, um grupo alquiltio C₁-C₆, um grupo alquilsulfonila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆, um grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilóxi C₁-C₆, um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆, um grupo cianoalcóxi C₁-C₆, um grupo acila
 20 C₁-C₆, um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆, um grupo di(alquil C₁-C₆) amino, ou um grupo Het¹ alcóxi C₁-C₆ (Het¹ tem o mesmo significado definido anteriormente), ou dois R¹² adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais eles são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros
 25 tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, enquanto que o anel assim formado pode ser substituído por um átomo de halogênio, um grupo alquila C₁-C₆ ou um grupo oxo; e

R¹³ é um grupo oxo, um átomo de halogênio, um grupo alquila

C₁-C₆, um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, ou um grupo mono(alquil C₁-C₆) amino.

(7) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com qualquer um de (1), (3), (4) e (5) anterior, em que na fórmula [I],

X¹ é um átomo de oxigênio;

X² é um átomo de nitrogênio;

R¹ é um átomo de hidrogênio; um grupo alquila C₁-C₁₂; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo haloalquenila C₂-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxicarbonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁸ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ em que o grupo arila pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁸ idênticos ou diferentes; um grupo Het² alquila C₁-C₆ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁹ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het² alquila C₁-C₆ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁹ idênticos ou diferentes; um grupo arila C₆-C₁₀ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes), isto é, um grupo arila C₆-C₁₀ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes; ou um Het² grupo (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes), isto é, um Het² grupo que pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes; em que Het² é 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, pirazol, isoxazol, piridina, 2,3-diidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol ou benzo-1,4-dioxano;

R² é um átomo de halogênio, um grupo alquila C₁-C₆; grupo alquiltio C₁-C₆ ou um grupo alcóxi C₁-C₆;

n representa um número inteiro de 0 a 4 em que X² é CH (o

grupo pode ser substituído por R^2), isto é, CH que pode ser substituído por R^2 , ou representa um número inteiro de 0 a 3 quando X^2 é $N(O)_m$;

R^3 é um grupo hidroxila;

R^8 é um átomo de halogênio, um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , ou um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ;

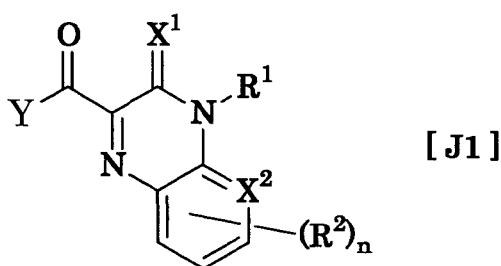
R^9 é um grupo alquila C_1-C_6 , um átomo de halogênio ou um grupo haloalquila C_1-C_6 ;

R^{12} é um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo cicloalquila C_3-C_8 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ou um grupo haloalquiltio C_1-C_6 , ou dois R^{12} adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais eles são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, enquanto que o anel assim formado pode ser substituído por um átomo de halogênio; e

R^{13} é um átomo de halogênio, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , ou um grupo alcóxi C_1-C_6 .

(8) Um composto representado pela fórmula [J1] :

[Fórmula química 2]



em que X^1 representa um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre;

X^2 representa CH (o átomo de carbono pode ser substituído por R^2) ou um átomo de nitrogênio;

R^1 representa um grupo alquila C_1-C_{12} ; um grupo alquenila C_2-

C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquenila C_2-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um
 5 grupo fenilóxi alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo tetraidrofurano alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; grupo cianoalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalquila C_1-C_6 ; um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo acil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcoxicarbonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ;
 10 C_6 ; um grupo ($R^6R^7N-C=O$) alquila C_1-C_6 ; um grupo aril C_6-C_{10} alquila C_1-C_6 (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^8 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo aril C_6-C_{10} alquila C_1-C_6 em que o grupo arila pode ser substituído por um ou dois ou mais R^8 idênticos ou diferentes; um grupo Het^1 -alquila C_1-C_6 (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het^1 -alquila C_1-C_6 que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes; um grupo $NR^{10}R^{11}$; um grupo arila C_6-C_{10} (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{12} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo arila C_6-C_{10} que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{12} idênticos ou diferentes; ou um grupo Het^1 (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{13} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het^1 que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{13} idênticos ou diferentes;

R^2 representa um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um
 25 grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; ou um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ;

n representa um número inteiro de 0 a 4 quando X^2 é CH (o grupo pode ser substituído por R^2), e n representa um número inteiro de 0 a 3 quando X^2 é átomo de nitrogênio;

R^6 e R^7 cada um independentemente representa um grupo alquila C_1-C_6 , e além disso, R^6 e R^7 podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual estes são ligados para formar um anel de 5 a 6 membros, enquanto que o anel assim formado pode ter um átomo de oxigênio interposto, além do átomo de nitrogênio ao qual R^6 e R^7 são ligados;

R^8 representa um átomo de halogênio; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; ou um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ;

R^9 representa um grupo alquila C_1-C_6 ; um átomo de halogênio; ou um grupo haloalquila C_1-C_6 ;

R^{10} e R^{11} cada um independentemente representa um grupo alquila C_1-C_6 ; ou um grupo alcóxicarbonila C_1-C_6 ;

R^{12} representa um átomo de halogênio; um grupo hidroxila; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquenilóxi C_2-C_6 ; um grupo alquililóxi C_2-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilóxi C_1-C_6 ; um grupo cianoalcóxi C_1-C_6 ; um grupo acila C_1-C_6 ; um grupo alcóxicarbonila C_1-C_6 ; um grupo di(alquil C_1-C_6) amino; ou um grupo Het¹ alcóxi C_1-C_6 , e além disso, dois R^{12} adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais eles são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, enquanto que o anel assim formado pode ser substituído por um átomo de halogênio; um grupo alquila C_1-C_6 ; ou um grupo oxo;

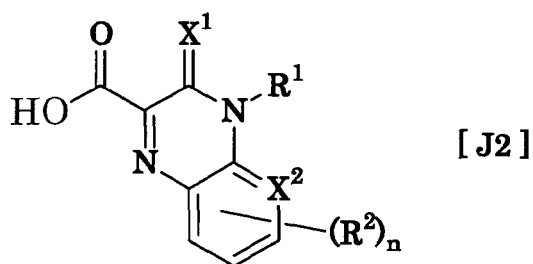
R^{13} representa um grupo oxo; um átomo de halogênio; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; ou um grupo mono(alquil C_1-C_6) amino;

Y representa um átomo de halogênio ou um grupo ciano; e

Het¹ representa tetraidrotiofeno, dióxido de tetraidrotiofeno, tetraidrotiopirano, dióxido de tetraidrotiopirano, 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-diidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano ou indol.

(9) Um composto representado pela fórmula [J2] :

[Fórmula química 3]



em que X¹ representa um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre;

10 X² representa CH (o átomo de carbono pode ser substituído por R²) ou um átomo de nitrogênio;

R¹ representa um grupo alquila C₁-C₁₂; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo haloalquenila C₂-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo fenilóxi alquila C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo tetraidrofurano alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; grupo cianoalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cianoalquila C₁-C₆; um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo acil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcoxicarbonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquila C₁-C₆; um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁸ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ em que o

grupo arila pode ser substituído por um ou dois ou mais R^8 idênticos ou diferentes; um grupo Het^1 -alquila C_1-C_6 (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het^1 -alquila C_1-C_6 que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes; um grupo $NR^{10}R^{11}$; um grupo arila C_6-C_{10} (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{12} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo arila C_6-C_{10} que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{12} idênticos ou diferentes; ou um grupo Het^1 (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{13} idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het^1 que pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{13} idênticos ou diferentes;

R^2 representa um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; ou um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ;

n representa um número inteiro de 0 a 4 quando X^2 é CH (o grupo pode ser substituído por R^2), e n representa um número inteiro de 0 a 3 quando X^2 é átomo de nitrogênio;

R^6 e R^7 cada um independentemente representa um grupo alquila C_1-C_6 , e além disso, R^6 e R^7 podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual estes são ligados para formar um anel de 5 a 6 membros, enquanto que o anel assim formado pode ter um átomo de oxigênio interposto, além do átomo de nitrogênio ao qual R^6 e R^7 são ligados;

R^8 representa um átomo de halogênio; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; ou um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ;

R^9 representa um grupo alquila C_1-C_6 ; um átomo de halogênio; ou um grupo haloalquila C_1-C_6 ;

R^{10} e R^{11} cada um independentemente representa um grupo alquila C_1-C_6 ; ou um grupo alcóxicarbonila C_1-C_6 ;

R^{12} representa um átomo de halogênio; um grupo hidroxila;

um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo alquenilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilóxi C₂-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilóxi C₁-C₆; um grupo cianoalcóxi C₁-C₆; um grupo acila C₁-C₆; um grupo alcoxycarbonila C₁-C₆; um grupo di(alquil C₁-C₆) amino; ou um grupo Het¹ alcóxi C₁-C₆, e além disso, dois R¹² adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais eles são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, enquanto que o anel assim formado pode ser substituído por um átomo de halogênio; um grupo alquila C₁-C₆; ou um grupo oxo;

R¹³ representa um grupo oxo; um átomo de halogênio; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; ou um grupo mono(alquil C₁-C₆) amino;

Het¹ representa tetraidrotiofeno, dióxido de tetraidrotiofeno, tetraidrotiopirano, dióxido de tetraidrotiopirano, 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-diidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano ou indol.

(10) O composto de acordo com (9) anterior, em que na fórmula [J2],

R¹ é um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo haloalquenila C₂-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo fenilóxi alquila C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo tetraidrofurano alcóxi

C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cianoalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cianoalquila C₁-C₆; um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo acil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcoxycarbonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquila C₁-C₆; um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁸ idênticos ou diferentes), um grupo Het¹-alquila C₁-C₆ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁹ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het¹-alquila C₁-C₆ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁹ idênticos ou diferentes; um grupo NR¹⁰R¹¹; ou um grupo Het¹ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes), isto é, um grupo Het¹ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes.

(11) O composto de acordo com (9) anterior, em que na fórmula [J2],

X² representa um átomo de nitrogênio; e

R¹ é um grupo arila C₆-C₁₀ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes), isto é, um grupo arila C₆-C₁₀ que pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes.

(12) Um herbicida caracterizado por compreender o derivado de oxopirazina de acordo com qualquer um de (1) a (7) anterior ou um sal do mesmo, as um ingrediente ativo.

(13) Um método para usar um herbicida caracterizado pelo tratamento do solo e/ou plantas com uma quantidade efetiva do herbicida de acordo com (12) anterior.

(14) Uma composição agroquímica para uso herbicida, compreendendo o derivado de oxopirazina de acordo com qualquer um de (1) a (7) anterior ou um sal do mesmo, e um veículo agroquimicamente aceitável.

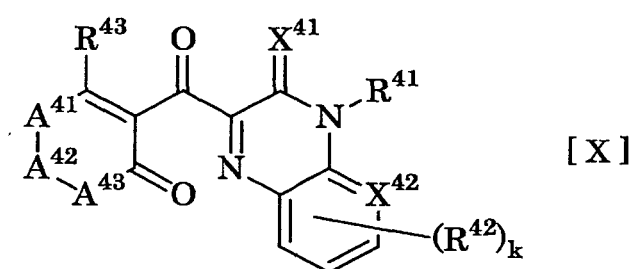
(15) Um método para suprimir o crescimento de ervas daninhas, o método incluindo espalhar uma composição agroquímica

contendo uma quantidade efetiva do derivado de oxopirazina de acordo com qualquer um de (1) a (7) anterior ou um sal do mesmo, por um lugar onde as ervas daninhas a ser removidas crescem.

5 A presente invenção também diz respeito ao seguinte (16) a (25).

(16) Um derivado de oxopirazina representado pela fórmula [X], ou um sal agroquimicamente aceitável do mesmo:

[Fórmula química 4]



em que X⁴¹ representa um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre;

10 X⁴² representa CH (o átomo de carbono pode ser substituído por R⁴²) ou N(O)_m;

m representa um número inteiro de 0 ou 1;

R⁴¹ representa um átomo de hidrogênio; um grupo amino; um grupo mono(alquil C₁-C₆) amino; um grupo di(alquil C₁-C₆) amino; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo alquila C₁-C₁₂ que pode ser substituído por qualquer grupo selecionado do grupo substituinte mostrado a seguir; um grupo cicloalquila C₃-C₆; um grupo alquenila C₂-C₆ que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte mostrado a seguir; um grupo alquinila C₂-C₆ que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte mostrado a seguir; um grupo fenila que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir; um grupo fenilalquila C₁-C₃ que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir; um grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de

15

20

oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (o grupo pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir); ou um grupo alquila C_1-C_3 heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (o grupo pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir);

R^{42} representa um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo cicloalquila C_3-C_6 , um grupo cicloalquil C_3-C_6 alquila C_1-C_3 , um grupo alquenila C_2-C_6 , um grupo alquinila C_2-C_6 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo cicloalquilóxi C_3-C_6 , um grupo alquenilóxi C_2-C_6 , um grupo alquinióxi C_2-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 , um grupo alquiltio C_1-C_6 , um grupo alquilsulfinila C_1-C_6 , um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 , um grupo haloalquiltio C_1-C_6 , um grupo haloalquilsulfinila C_1-C_6 , um grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 , um grupo amino, um grupo mono(alquil C_1-C_6) amino, um grupo di(alquil C_1-C_6) amino, um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 , um grupo acila C_1-C_6 , um grupo carboxila, um grupo alcoxicarbonila C_1-C_6 , um grupo mono(alquil C_1-C_6) aminocarbonila, ou um grupo di(alquil C_1-C_6) aminocarbonila;

n representa um número inteiro de 0 a 4 quando X_{42} é CH (o grupo pode ser substituído por R^{42}), ou n representa um número inteiro de 0 a 3 quando X_{42} é $N(O)_m$;

R^{43} representa um grupo hidroxila, O-M+(em que M+ representa um cátion de metal alcalino ou um cátion amônio), um grupo amino, um átomo de halogênio, um grupo alquilsulfonilóxi C_1-C_6 , um grupo alquiltio C_1-C_6 , um grupo alquilsulfinila C_1-C_6 , um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 , um grupo haloalquiltio C_1-C_6 , um grupo haloalquilsulfinila C_1-C_6 , um grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 , um grupo alqueniltio C_2-C_6 , um grupo alquenilsulfinil C_2-C_6 , um grupo alquenilsulfonil C_2-C_6 , um grupo alquinitio

C₂-C₆, um grupo alquinilsulfinila C₂-C₆, um grupo alquinilsulfonila C₂-C₆, um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆, um grupo alquenilcarbonilóxi C₂-C₆, um grupo alquinilcarbonilóxi C₂-C₆, um grupo fenóxi que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte γ mostrado a seguir, um grupo
 5 feniltio que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte γ mostrado a seguir, um grupo fenilsulfinila que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte γ mostrado a seguir, um grupo fenilsulfonila que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte γ mostrado a seguir, um grupo
 10 fenilsulfonilóxi que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte γ mostrado a seguir, um grupo fenilcarbonilóxi que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte γ mostrado a seguir, um grupo 1,2,4-triazol-1-ila, um grupo 1,2,3-triazol-1-ila, um grupo 1,2,3-triazol-2-ila, grupo um imidazol-1-ila, um grupo pirazol-1-ila, um grupo
 15 tetrazol-1-ila ou um grupo tetrazol-2-ila;

A^{41} representa $C(R^{44}R^{45})$;

A^{42} representa $C(R^{46}R^{47})$ ou $C=O$;

A^{43} representa $C(R^{48}R^{49})$; e

R^{44} , R^{45} , R^{46} , R^{47} , R^{48} e R^{49} cada um independentemente
 20 representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁-C₆, ou R^{44} e R^{49} podem ser unidos por uma cadeia de alquilenos C₂-C₅ para constituir um anel.

[Grupo substituinte α]

Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo alquila C₁-C₆, um grupo
 25 cicloalquila C₃-C₆, um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo cicloalquilóxi C₃-C₆, um grupo haloalcóxi C₁-C₆, um grupo fenóxi, um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆, um grupo alquiltio C₁-C₆, um grupo alquilsulfinila C₁-C₆, um grupo alquilsulfonila C₁-C₆, um grupo amino, um grupo mono(alquil C₁-C₆) amino, um grupo di(alquil C₁-C₆) amino, um grupo

alcóxi C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, um grupo alquilsulfonil C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, um grupo cianoalcóxi C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₃ heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos arbitrariamente selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, um grupo
 5 acila C₁-C₆, um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆, e um grupo R⁵⁰R⁵¹N-C=O (R⁵⁰ e R⁵¹ cada um independentemente representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁-C₆, ou R⁵⁰ e R⁵¹ podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados para formar um anel de 5 a 6 membros, enquanto que este anel pode ter um ou mais átomos arbitrariamente
 10 selecionados do grupo de um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, interpostos nele, além do átomo de nitrogênio ao qual R⁵⁰ e R⁵¹ são ligados).

[Grupo substituinte β]

Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo
 15 hidroxila, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo alquila C₁-C₆, um grupo cicloalquila C₃-C₆, um grupo cicloalquil C₃-C₆ alquila C₁-C₃, um grupo alquenila C₂-C₆, um grupo alquinila C₂-C₆, um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo cicloalquilóxi C₃-C₆, um grupo alquenilóxi C₂-C₆, um grupo alquinilóxi C₂-C₆, um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆, um grupo
 20 haloalcóxi C₁-C₆, um grupo alquiltio C₁-C₆, um grupo alquilsulfinila C₁-C₆, um grupo alquilsulfonila C₁-C₆, um grupo haloalquiltio C₁-C₆, um grupo haloalquilsulfinila C₁-C₆, um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆, um grupo amino, um grupo mono(alquil C₁-C₆) amino, um grupo di(alquil C₁-C₆) amino, um C₁-C₃ grupo alcóxi alquila C₁-C₃, um grupo alcóxi C₁-C₆ alcóxi
 25 C₁-C₆, um grupo cicloalquil C₃-C₆ alquilóxi C₁-C₃, um grupo cianoalcóxi C₁-C₃, um grupo acila C₁-C₆, um grupo carboxila, um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆, um grupo carbamoila, um grupo mono (alquil C₁-C₁₀) aminocarbonila, um grupo di (alquil C₁-C₁₀) aminocarbonila, e um grupo alcóxi C₁-C₃ heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos

arbitrariamente selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio;

[Grupo substituinte γ]

Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo
5 nitro, um grupo ciano, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , e um grupo haloalcóxi C_1-C_6 .

(17) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com (11) anterior, em que na fórmula [X], X42 é CH (o átomo de carbono pode ser substituído por R^{42}).

10 (18) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com (11) anterior, em que na fórmula [X], X42 é $N(O)_m$.

(19) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com (16) a (18) anterior, em que na fórmula
15 [X],

X41 é um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre;

X42 é CH (o átomo de carbono pode ser substituído por R^{42})
ou um átomo de nitrogênio;

R^{41} é um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C_1-C_{12} que
20 pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte mostrado a seguir, um grupo cicloalquila C_3-C_6 , um grupo alquenila C_2-C_6 , um grupo alquinila C_2-C_6 , um grupo fenila que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir, um grupo fenilalquila C_1-C_3 que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo
25 substituinte β mostrado a seguir, um grupo heterocíclico selecionado do grupo de anel heterocíclico Z mostrado a seguir (o grupo pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir), ou um grupo alquila C_1-C_3 heterocíclico em que a fração heterocíclica é selecionado do grupo de anel heterocíclico Z mostrado a seguir (o grupo pode ser

substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir);

R^{42} é um átomo de halogênio, um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo alquiltio C_1-C_6 , ou um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ;

5 n é um número inteiro de 0 a 4 quando X_{42} é CH (o átomo de carbono pode ser substituído por R^{42}), ou n é um número inteiro de 0 a 3 quando X_{42} é um átomo de nitrogênio; e

R^{43} é um grupo hidroxila.

[Grupo substituinte α]

10 Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 , um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 , um grupo cianoalcóxi C_1-C_6 , um grupo fenóxi, um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica é selecionado

15 do grupo de anel heterocíclico Z mostrado a seguir, um grupo alquiltio C_1-C_6 , um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 , um grupo acila C_1-C_6 , um grupo alcoxicarbonila C_1-C_6 , e um grupo $R^{50}R^{51}N-C=O$ (R^{50} e R^{51} cada um independentemente representa um grupo alquila C_1-C_6 , ou R^{50} e R^{51} podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados para formar um

20 anel de 5 a 6 membros, enquanto que este anel pode ter um átomo de oxigênio interposto, além do átomo de nitrogênio ao qual R^{50} e R^{51} são ligados).

[Grupo substituinte β]

Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo

25 haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 , um grupo alquenilóxi C_2-C_6 , um grupo alquinilóxi C_2-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica é selecionado do grupo de anel heterocíclico Z mostrado a seguir, um grupo alquiltio C_1-C_6 , um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 , um C_1-C_3 grupo alcóxi alquila C_1-C_3 , um grupo

cicloalquil C₃-C₆ alquilóxi C₁-C₃, um grupo cianoalcóxi C₁-C₃, e um grupo acila C₁-C₆.

[Grupo do anel heterocíclico Z]

Um grupo compreendendo tetraidrofurano, tetraidrotiofeno, dióxido de tetraidrotiofeno, tetraidrotiopirano, dióxido de tetraidrotiopirano, 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-oxadiazol, piridina, pirimidina, 2,3-diidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, e benzo-1,4-dioxano.

(20) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com qualquer um de (16) a (19) anterior, em que na fórmula [X],

X41 representa um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre,

X42 é CH (o grupo pode ser substituído por R⁴²),

R⁴¹ é um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C₁-C₁₂ que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte mostrado a seguir, um grupo cicloalquila C₃-C₆, um grupo alquenila C₂-C₆, um grupo alquinila C₂-C₆, um grupo fenila que pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir, um grupo fenilalquila C₁-C₃ que pode ser substituído por qualquer grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir, um grupo heterocíclico selecionado do grupo de anel heterocíclico Z mostrado a seguir (o grupo pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir), ou um grupo alquila C₁-C₃ heterocíclico em que a fração heterocíclica é selecionada do seguinte grupo de anel heterocíclico Z (o grupo pode ser substituído por um grupo selecionado do grupo substituinte β mostrado a seguir);

R⁴² é um átomo de halogênio, um grupo alquiltio C₁-C₆ ou um grupo alquilsulfonila C₁-C₆;

n é um número inteiro de 0 a 4; e

R^{43} é um grupo hidroxila.

[Grupo substituinte α]

Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 , um grupo
 5 alquilsulfonil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 , um grupo cianoalcóxi C_1-C_6 , um grupo fenóxi, um grupo haloalcóxi C_1-C_6 , um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_{10} heterocíclico em que a fração heterocíclica é selecionada do seguinte grupo de anel heterocíclico Z, um grupo alquiltio C_1-C_6 , um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 , um grupo acila C_1-C_6 , um grupo alcoxycarbonila
 10 C_1-C_6 , e um grupo $R^{50}R^{51}N-C=O$ (R^{50} e R^{51} cada um independentemente representa um grupo alquila C_1-C_6 , ou R^{50} e R^{51} podem ser unidos com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados para formar um anel de 5 a 6 membros, enquanto que este anel pode ter um átomo de oxigênio interposto, além do átomo de nitrogênio ao qual R^{50} e R^{51} são ligados).

15 [Grupo substituinte β]

Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 , um grupo haloalcóxi C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_{10} heterocíclico em que a fração heterocíclica é selecionado
 20 do grupo de anel heterocíclico Z mostrado a seguir, um grupo alquiltio C_1-C_6 , um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 , um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 , um grupo cicloalquil C_3-C_6 alquilóxi C_1-C_3 , um grupo cianoalcóxi C_1-C_3 , e um grupo acila C_1-C_6 .

[Grupo do anel heterocíclico Z]

25 Um grupo compreendendo tetraidrofurano, tetraidrotiofeno, dióxido de tetraidrotiofeno, tetraidrotiopirano, dióxido de tetraidrotiopirano, 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-oxadiazol, piridina, pirimidina, 2,3-diidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, e benzo-1,4-dioxano.

(21) O derivado de oxopirazina ou o sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com qualquer um de (16) a (20) anterior, em que na fórmula [X],

X^{41} é um átomo de oxigênio;

5 X^{42} é um átomo de nitrogênio;

R^{41} é um grupo alquila C_1-C_{12} que pode ser substituído por qualquer grupo selecionado do seguinte grupo substituinte α , um grupo alquenila C_2-C_6 , um grupo alquinila C_2-C_6 , um grupo fenila que pode ser substituído por qualquer grupo selecionado do seguinte grupo substituinte β ,
10 um grupo fenil alquila C_1-C_3 , um grupo heterocíclico selecionado do seguinte grupo heterocíclico Z (o grupo pode ser substituído por qualquer grupo selecionado do seguinte grupo substituinte β), ou um grupo alquila C_1-C_3 heterocíclico selecionado do seguinte grupo heterocíclico Z (o grupo pode ser substituído por qualquer grupo selecionado do seguinte grupo substituinte β);

15 R^{42} é um átomo de halogênio ou um grupo alcóxi C_1-C_6 ;

n é um número inteiro de 0 a 3;

R^{43} é um grupo hidroxila;

A^{41} é CHR^{44} ;

A^{42} é CH_2 ;

20 A^{43} é CHR^{49} ;

R^{44} e R^{49} são átomo de hidrogênios, ou R^{44} e R^{49} podem ser unidos por uma cadeia de alquilenos C_2-C_5 para constituir um anel.

[Grupo substituinte α]

25 Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo alcóxi C_1-C_6 , e um grupo alcóxicarbonila C_1-C_6 .

[Grupo substituinte β]

Um grupo compreendendo um átomo de halogênio, um grupo alquila C_1-C_6 , um grupo haloalquila C_1-C_6 , e um grupo alcóxi C_1-C_6 .

[Grupo do anel heterocíclico Z]

Um grupo compreendendo 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, isoxazol, piridina, 1,3-benzodioxol, e benzo-1,4-dioxano.

(22) Um herbicida caracterizado por compreender o derivado de oxopirazina de acordo com qualquer um de (16) a (21) anterior ou um sal do mesmo, como um ingrediente ativo.

(23) Um método para usar um herbicida caracterizado pelo tratamento do solo e/ou plantas com uma quantidade efetiva do herbicida de acordo com (22) anterior.

(24) Uma composição agroquímica para uso herbicida, compreendendo o derivado de oxopirazina de acordo com qualquer um de (16) a (21) anterior ou um sal do mesmo, e um veículo agroquimicamente aceitável deste.

(25) Um método para suprimir o crescimento de ervas daninhas, o método incluindo espalhar uma composição agroquímica contendo uma quantidade efetiva do derivado de oxopirazina de acordo com qualquer um de (16) a (21) anterior ou um sal do mesmo, em um lugar onde as ervas daninhas a ser removidas crescem.

O derivado de oxopirazina representado pela fórmula [I] ou um sal do mesmo de acordo com a presente invenção foi rescrito com base na descrição do derivado de oxopirazina representado pela fórmula [X] ou um sal do mesmo.

No presente pedido de patente, todos os assuntos em questão descritos no pedido de patente japonês JP No. 2007-201387, com base em que o presente pedido de patente reivindica prioridade, foram incorporados na descrição da presente especificação.

EFEITO DA INVENÇÃO

O derivado de oxopirazina representado pela fórmula [I] ou um sal agroquimicamente aceitável do mesmo de acordo com a presente invenção pode controlar várias ervas daninhas que crescem em campos não

plantados, pomares, campos de arroz e terras não agrícolas, e tem excelentes efeitos na ação como um produto agroquímico, mostrando alta segurança contra plantas úteis, lavouras úteis e similares.

MELHOR MODO DE REALIZAR A INVENÇÃO

5 Os símbolos e termos descritos no presente pedido de patente serão explicados.

O átomo de halogênio é um átomo de flúor, um átomo de cloro, um átomo de bromo ou um átomo de iodo.

10 Uma notação que mostra símbolos elementares e números subscritos, tal como em C_1-C_3 , indica que o número de elementos do grupo descrito subsequentemente à notação é na faixa indicada pelos números subscritos. Por exemplo, neste caso, é indicado que o número de carbono seja 1 a 3. A notação de C_1-C_6 indica que o número de carbono é 1 a 6, enquanto que a notação de C_1-C_{12} indica que o número de carbono é 1 a 12.

15 O grupo alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, e grupos, tais como metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, sec-butila, isobutila, terc-butila, n-pentila, 1-metilbutila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 1-etilpropila, 1,1-dimetilpropila, 1,2-dimetilpropila, neopentila, n-
20 hexila, 1-metilpentila, 2-metilpentila, 3-metilpentila, 4-metilpentila, 1-etilbutila, 2-etilbutila, 1,1-dimetilbutila, 1,2-dimetilbutila, 1,3-dimetilbutila, 2,2-dimetilbutila, 2,3-dimetilbutila, 3,3-dimetilbutila, 1,1,2-trimetilpropila, 1,2,2-trimetilpropila, 1-etil-1-metilpropila e 1-etil-2-metilpropila podem ser incluídos, por exemplo. Um grupo alquila preferido tendo 1 a 6 átomos de
25 carbono pode ser exemplificado por um grupo alquila de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 4, ou 1 a 3, átomos de carbono.

O grupo alquila C_1-C_{12} representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 12 átomos de carbono, e além dos exemplos do grupo alquila C_1-C_6 ,

grupos, tais como n-heptila, 1-metilexila, 5-metilexila, 1,1-dimetilpentila, 2,2-dimetilpentila, 4,4-dimetilpentila, 1-etilpentila, 2-etilpentila, 1,1,3-trimetilbutila, 1,2,2-trimetilbutila, 1,3,3-trimetilbutila, 2,2,3-trimetilbutila, 2,3,3-trimetilbutila, 1-propilbutila, 1,1,2,2-tetrametilpropila, n-octila, 1-metileptila, 3-metileptila, 6-metileptila, 2-etilexila, 5,5-dimetilexila, 2,4,4-trimetilpentila, 1-etil-1-metilpentila, nonila, 1-metiloctila, 2-metiloctila, 3-metiloctila, 7-metiloctila, 1-etileptila, 1,1-dimetileptila, 6,6-dimetileptila, decila, 1-metilnonila, 2-metilnonila, 6-metilnonila, 1-etiloctila, 1-propilheptila, n-nonila, n-decila, n-undecila e n-dodecila podem ser incluídos, por exemplo. Um grupo alquila preferido tendo 1 a 12 átomos de carbono pode ser exemplificado por um grupo alquila de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 8, 1 a 6, ou 1 a 3, átomos de carbono.

O grupo cicloalquila C_3-C_8 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo cicloalquila tendo 3 a 8 átomos de carbono, e grupos, tais como ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e cicloexila podem ser incluídos, por exemplo. Um grupo cicloalquila preferido tendo 3 a 8 átomos de carbono pode ser exemplificado por um grupo cicloalquila tendo 3 a 6, ou 4 a 6, átomos de carbono.

O grupo cicloalquil C_3-C_8 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo cicloalquila tendo 3 a 8 átomos de carbono, em que a fração cicloalquila e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como ciclopropilmetila, 1-ciclopropiletila, 2-ciclopropiletila, 1-ciclopropilpropila, 2-ciclopropilpropila, 3-ciclopropilpropila, ciclobutilmetila, ciclopentilmetila e cicloexilmetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalquila C_1-C_6 representa um grupo alquila de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um ou mais, preferivelmente 1 a 10, e mais preferivelmente 1 a 5, átomos de

halogênio, e grupos, tais como fluorometila, clorometila, bromometila, difluorometila, diclorometila, trifluorometila, triclorometila, clorodifluorometila, bromodifluorometila, 2-fluoretila, 1-cloroetila, 2-cloroetila, 1-bromoetila, 2-bromoetila, 2,2-difluoretila, 1,2-dicloroetila, 2,2-dicloroetila, 2,2,2-trifluoretila, 2,2,2-tricloroetila, 1,1,2,2-tetrafluoretila, pentafluoretila, 2-bromo-2-cloroetila, 2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoretila, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoretila, 1-cloropropila, 2-cloropropila, 3-cloropropila, 2-bromopropila, 3-bromopropila, 2-bromo-1-metiletila, 3-iodopropila, 2,3-dicloropropila, 2,3-dibromopropila, 3,3,3-trifluoropropila, 3,3,3-tricloropropila, 3-bromo-3,3-difluoropropila, 3,3-dicloro-3-fluoropropila, 2,2,3,3-tetrafluoropropila, 1-bromo-3,3,3-trifluoropropila, 2,2,3,3,3-pentafluoropropila, 2,2,2-trifluor-1-trifluorometiletila, heptafluoropropila, 1,2,2,2-tetrafluor-1-trifluorometiletila, 2,3-dicloro-1,1,2,3,3-pentafluoropropila, 2-clorobutila, 3-clorobutila, 4-clorobutila, 2-cloro-1,1-dimetiletila, 4-bromobutila, 3-bromo-2-metilpropila, 2-bromo-1,1-dimetiletila, 2,2-dicloro-1,1-dimetiletila, 2-cloro-1-clorometil-2-metiletila, 4,4,4-trifluorobutila, 3,3,3-trifluor-1-metilpropila, 3,3,3-trifluor-2-metilpropila, 2,3,4-triclorobutila, 2,2,2-tricloro-1,1-dimetiletila, 4-cloro-4,4-difluorobutila, 4,4-dicloro-4-fluorobutila, 4-bromo-4,4-difluorobutila, 2,4-dibromo-4,4-difluorobutila, 3,4-dicloro-3,4,4-trifluorobutila, 3,3-dicloro-4,4,4-trifluorobutila, 4-bromo-3,3,4,4-tetrafluorobutila, 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluorobutila, 2,2,3,3,4,4-hexafluorobutila, 2,2,3,4,4,4-hexafluorobutila, 2,2,2-trifluor-1-metil-1-trifluorometiletila, 3,3,3-trifluor-2-trifluorometilpropila, 2,2,3,3,4,4,4-heptafluorobutila, 2,3,3,3-tetrafluor-2-trifluorometilpropila, 1,1,2,2,3,3,4,4-octafluorobutila, nonafluorobutila, 4-cloro-1,1,2,2,3,3,4,4-octafluorobutila, 5-fluoropentila, 5-cloropentila, 5,5-difluoropentila, 5,5-dicloropentila, 5,5,5-trifluoropentila, 6,6,6-trifluorexila e 5,5,5,6,6,6-hexafluorexila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquenila C₂-C₆ representa, a menos que

particularmente limitado, um grupo alquenila de cadeia reta ou ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono, e grupos, tais como vinila, 1-propenila, isopropenila, 2-propenila, 1-butenila, 1-metil-1-propenila, 2-butenila, 1-metil-2-propenila, 3-butenila, 2-metil-1-propenila, 2-metil-2-propenila, 1,3-butadienila, 1-pentenila, 1-etil-2-propenila, 2-pentenila, 1-metil-1-butenila, 3-pentenila, 1-metil-2-butenila, 4-pentenila, 1-metil-3-butenila, 3-metil-1-butenila, 1,2-dimetil-2-propenila, 1,1-dimetil-2-propenila, 2-metil-2-butenila, 3-metil-2-butenila, 1,2-dimetil-1-propenila, 2-metil-3-butenila, 3-metil-3-butenila, 1,3-pentadienila, 1-vinil-2-propenila, 1-hexenila, 1-propil-2-propenila, 2-hexenila, 1-metil-1-pentenila, 1-etil-2-butenila, 3-hexenila, 4-hexenila, 5-hexenila, 1-metil-4-pentenila, 1-etil-3-butenila, 1-(isobutil)vinila, 1-etil-1-metil-2-propenila, 1-etil-2-metil-2-propenila, 1-(isopropil)-2-propenila, 2-metil-2-pentenila, 3-metil-3-pentenila, 4-metil-3-pentenila, 1,3-dimetil-2-butenila, 1,1-dimetil-3-butenila, 3-metil-4-pentenila, 4-metil-4-pentenila, 1,2-dimetil-3-butenila, 1,3-dimetil-3-butenila, 1,1,2-trimetil-2-propenila, 1,5-hexadienila, 1-vinil-3-butenila e 2,4-hexadienila podem ser incluídos, por exemplo. Um grupo alquenila preferido tendo 2 a 6 átomos de carbono pode ser exemplificado por um grupo alquenila de cadeia reta ou ramificada tendo 2 a 4 átomos de carbono.

O grupo alquinila C_2-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquinila de cadeia reta ou ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono, e grupos, tais como etinila, 1-propinila, 2-propinila, 1-butinila, 1-metil-2-propinila, 2-butinila, 3-butinila, 1-pentinila, 1-etil-2-propinila, 2-pentinila, 3-pentinila, 1-metil-2-butinila, 4-pentinila, 1-metil-3-butinila, 2-metil-3-butinila, 1-hexinila, 1-(n-propil)-2-propinila, 2-hexinila, 1-etil-2-butinila, 3-hexinila, 1-metil-2-pentinila, 1-metil-3-pentinila, 4-metil-1-pentinila, 3-metil-1-pentinila, 5-hexinila, 1-etil-3-butinila, 1-etil-1-metil-2-propinila, 1-(isopropil)-2-propinila, 1,1-dimetil-2-butinila e 2,2-dimetil-3-butinila podem ser incluídos, por exemplo. Um grupo alquinila

preferido tendo 2 a 6 átomos de carbono pode ser exemplificado por um grupo alquinila de cadeia reta ou ramificada tendo 2 a 4 átomos de carbono.

O grupo alcóxi C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alcóxi de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, e grupos, tais como metóxi, etóxi, propóxi, isopropóxi, butóxi, pentilóxi e hexilóxi podem ser incluídos, por exemplo. Um grupo alcóxi preferido tendo 1 a 6 átomos de carbono pode ser exemplificado por um grupo alcóxi de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 4, ou 1 a 3, átomos de carbono.

10 O grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquila e a fração alcóxi respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como metoximetila, etoximetila, 15 isopropoximetila, pentiloximetila, metoxietila e butoxietila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 representa um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alcóxi tem o mesmo significado definido 20 anteriormente, e grupos, tais como metoximetóxi, etoximetóxi, 2-metoxietóxi e 2-etoxietóxi podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo cicloalquil C_3-C_8 alquilóxi C_1-C_6 representa um grupo (alquil)-O- tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo cicloalquila tendo 3 a 8 átomos de carbono, em que a fração cicloalquila e a 25 fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como ciclopropilmetilóxi, ciclopropiletilóxi e ciclopentilmetilóxi podem ser incluídos, por exemplo. Um grupo cicloalquila preferido tendo 3 a 8 átomos de carbono pode ser exemplificado por um grupo cicloalquila tendo 3 a 6 átomos de carbono.

O grupo cianoalcóxi C_1-C_6 representa um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo ciano, em que a fração alcóxi tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-cianoetóxi e 3-cianopropóxi podem ser incluídos, por exemplo.

5 O grupo cicloalquilóxi C_3-C_8 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo (cicloalquil)-O- tendo 3 a 8 átomos de carbono em que a fração cicloalquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como ciclopropilóxi, ciclobutilóxi, ciclopentilóxi e cicloexilóxi podem ser incluídos, por exemplo.

10 O grupo alquenilóxi C_2-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo (alquenil)-O- tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquenila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-propenilóxi podem ser incluídos, por exemplo.

15 O grupo alquinilóxi C_2-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo (alquinil)-O- tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquinila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-propinilóxi podem ser incluídos, por exemplo.

20 O grupo alquiltio C_1-C_6 representa um grupo (alquil)-S- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como metiltio, etiltio, n-propiltio e isopropiltio podem ser incluídos, por exemplo.

25 O grupo alquilsulfanila C_1-C_6 representa um grupo (alquil)-SO- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como metilsulfanila, etilsulfanila, n-propilsulfanila e isopropilsulfanila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquilsulfonila C_1-C_6 representa um grupo (alquil)-

SO₂- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como metilsulfonila, etilsulfonila, n-propilsulfonila e isopropilsulfonila podem ser incluídos, por exemplo.

5 O grupo alquilsulfonilóxi C₁-C₆ representa um grupo (alquil)-SO₂-O- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como metilsulfonilóxi e etilsulfonilóxi podem ser incluídos, por exemplo.

10 O grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ representa um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alquilsulfonila tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquilsulfonila e a fração alcóxi respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-(metilsulfonil)etóxi e 2-(etilsulfonil)etóxi podem ser incluídos, por exemplo.

15 O grupo mono(alquil C₁-C₆)amino representa um grupo (alquil)-NH- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como metilamino e etilamino podem ser incluídos, por exemplo.

20 O grupo di(alquil C₁-C₆)amino representa um grupo (alquil)₂N- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como dimetilamino, dietilamino, metiletilamino, dipropilamino e dibutilamino podem ser incluídos, por exemplo.

25 O grupo mono(alquil C₁-C₆)aminocarbonila representa um grupo (alquil)-NH-C(=O)- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como metilaminocarbonila e etilaminocarbonila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo di(alquil C₁-C₆)aminocarbonila representa um grupo (alquil)₂N-C(=O)- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem

o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como dimetilaminocarbonila, dietilaminocarbonila, metiletilaminocarbonila, dipropilaminocarbonila e dibutilaminocarbonila podem ser incluídos, por exemplo.

5 O grupo alcoxicarbonila C_1-C_6 representa um grupo (alquil)- $OC(=O)-$ tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como metoxicarbonila, etoxicarbonila, n-propoxicarbonila e isopropoxicarbonila podem ser incluídos, por exemplo.

10 O grupo acila C_1-C_6 representa um grupo acila derivado de um ácido carboxílico alifático de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, e grupos, tais como formila, acetila, propionila, isopropionila, butirila e pivaloila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 representa um grupo (alquil)-
15 $C(=O)-O-$ tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como acetóxi, propionilóxi, isopropionilóxi e pivaloilóxi podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquenilcarbonilóxi C_2-C_6 representa um grupo (alquenil)- $C(=O)-O-$ tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquênica tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 1-
20 propenilcarbonilóxi, 2-propenilcarbonilóxi, 1-butenilcarbonilóxi e 1-metil-1-propenilcarbonilóxi podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquinilcarbonilóxi C_2-C_6 representa um grupo (alquinil)- $C(=O)-O-$ tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquínica tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 1-
25 propinilcarbonilóxi e 2-propinilcarbonilóxi podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalquiltio C_1-C_6 representa um grupo (haloalquil)- $S-$ tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração haloalquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como difluorometiltio e

trifluorometiltio podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalquilsulfinila C_1-C_6 representa um grupo (haloalquil)-SO- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração haloalquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como
 5 clorometilsulfinila, difluorometilsulfinila e trifluorometilsulfinila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 representa um grupo (haloalquil)-SO₂- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração haloalquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como
 10 clorometilsulfonila, difluorometilsulfonila e trifluorometilsulfonila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo mono(alquil C_1-C_6)aminocarbonila representa um grupo (alquil)NH-C(=O)- tendo 1 a 6 átomos de carbono em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como
 15 metilaminocarbonila e etilaminocarbonila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo di(alquil C_1-C_6)aminocarbonila representa um grupo (alquil)₂N-C(=O)- em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como dimetilaminocarbonila, dietilaminocarbonila, metiletilaminocarbonila, dipropilaminocarbonila e
 20 dibutilaminocarbonila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alqueniltio C_2-C_6 representa um grupo (alquenil)-S- tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquenila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como aliltio podem ser incluídos, por exemplo.

25 O grupo alquenilsulfinila C_2-C_6 representa um (grupo alquenil)-SO- tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquenila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como alilsulfinila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquenilsulfonila C_2-C_6 representa um grupo

(alquenil)-SO₂- tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquenila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como alilsulfonila podem ser incluídos, por exemplo.

5 O grupo alquiniltio C₂-C₆ representa um grupo (alquinil)-S- tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquinila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-propiniltio podem ser incluídos, por exemplo.

10 O grupo alquinilsulfinila C₂-C₆ representa um grupo (alquinil)-SO- tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquinila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-propinilsulfinila podem ser incluídos, por exemplo.

15 O grupo alquinilsulfonila C₂-C₆ representa um (alquinil)-SO₂- tendo 2 a 6 átomos de carbono em que a fração alquinila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-propinilsulfonila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo fenil alquila C₁-C₆ representa um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo fenila, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como benzila, 1-feniletila e 2-feniletila podem ser incluídos, por exemplo.

20 O grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, representa, a menos que particularmente limitado, um grupo monovalente formado de um anel heterocíclico de 3 a 8 membros e preferivelmente de 5 a 7 membros monocíclico, policíclico ou fundido no anel
25 tendo 1 a 5, e preferivelmente 1 a 3, heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e grupos, tais como oxirano, tetraidrofurano, pirrolidina, tetraidrotiofeno, dióxido de tetraidrotiofeno, tetraidrotiopirano, dióxido de tetraidrotiopirano, 4,5-diidroisoxazol, piperidina, piperazina, morfolina,

furano, tiofeno, pirrol, pirazol, imidazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,3,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, 1,3,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,2,4-tiadiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,3-oxadiazol, 1,2,3-tiadiazol, 1,2,3-triazol, tetrazol, piridina, pirimidina, pirazina, piridazina, 1,3,5-triazina, 1,2,4-triazina, benzotiofeno, benzofurano, indol, benzoxazol, benzotiazol, benzimidazol, benzisoxazol, benzisotiazol, indazol, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano e 2,3-diidrobenezofurano podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquila C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo heterocíclico em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como (tetraidrofuran-2-il)metila, (4,5-diidroisoxazol-5-il)metila, (isoxazol-5-il)metila e (tiofen-2-il)metila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alcóxi C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, representa um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, em que a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, e a fração alcóxi respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como (tetraidrofuran-2-il)metóxi e (tetraidrofuran-3-il)metóxi podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo heterocíclico alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos

selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, representa um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono, que é substituído com um grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, em que a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio, a fração alcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

10 Grupos, tais como (tetraidrofurano-2-il)metoximetila e (tetraidrofurano-3-il)metoximetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalquênico C_2-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquênico de cadeia reta ou ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono substituídos por 1 a 11, e preferivelmente 1 a 5, átomos de halogênio, e grupos, tais como 2-clorovinila, 2-bromovinila, 2-iodovinila, 3-cloro-2-propenila, 3-bromo-2-propenila, 1-clorometilvinila, 2-bromo-1-metilvinila, 1-trifluorometilvinila, 3,3,3-tricloro-1-propenila, 3-bromo-3,3-difluor-1-propenila, 2,3,3,3-tetracloro-1-propenila, 1-trifluorometil-2,2-difluorovinila, 2-cloro-2-propenila, 3,3-difluor-2-propenila, 2,3,3-tricloro-2-propenila, 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluor-1-butenila, 1-bromometil-2-propenila, 3-cloro-2-butenila, 4,4,4-trifluor-2-butenila, 4-bromo-4,4-difluor-2-butenila, 3-bromo-3-butenila, 3,4,4-trifluor-3-butenila, 3,4,4-tribromo-3-butenila, 3-bromo-2-metil-2-propenila, 3,3-difluor-2-metil-2-propenila, 3,3,3-trifluor-2-metilpropenila, 3-cloro-4,4,4-trifluor-2-butenila, 3,3,3-trifluor-1-metil-1-propenila, 3,4,4-trifluor-1,3-butadienila, 3,4-dibromo-1-pentenila, 4,4-difluor-3-metil-3-butenila, 3,3,4,4,5,5,5-heptafluor-1-pentenila, 5,5-difluor-4-pentenila, 4,5,5-trifluor-4-pentenila, 3,4,4,4-tetrafluor-3-trifluorometil-1-butenila, 4,4,4-trifluorometil-3-metil-2-butenila, 3,5,5-trifluor-2,4-pentadienila, 4,4,5,5,6,6,6-heptafluor-2-hexenila,

3,4,4,5,5,5-hexaflúor-3-trifluorometil-1-pentenila, 4,5,5,5-tetraflúor-4-trifluorometil-2-pentenila e 5-bromo-4,5,5-triflúor-4-trifluorometil-2-pentenila podem ser incluídos, por exemplo.

5 O grupo haloalquilina C_2-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquilina de cadeia reta ou ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono substituídos por 1 a 4 átomos de halogênio idênticos ou diferentes, e grupos, tais como 3-cloro-2-propinila, 3-bromo-2-propinila, 3-iodo-2-propinila, 3-cloro-1-propinila e 5-cloro-4-pentinila podem ser incluídos, por exemplo.

10 O grupo aminoalquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo amino, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-aminoetila e 3-aminopropila podem ser incluídos, por exemplo.

15 O grupo mono(alquil C_1-C_6) aminoalquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo amino que é mono-substituído por um grupo alquila, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-(metilamino)etila e 3-(metilamino)propila podem ser incluídos, por exemplo.

20 O grupo di(alquil C_1-C_6) aminoalquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo amino que é di-substituído por grupos alquila, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como N,N-dimetilaminometila e N,N-dimetilaminoetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono

substituídos por um grupo alquiltio tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquila e a fração alquila do alquiltio respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como metiltiometila e etiltiometila podem ser incluídos, por exemplo.

5 O grupo alquilsulfinil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alquilsulfanila tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquila e a fração alquila do alquilsulfinila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como
10 metilsulfinilmetila e etilsulfinilmetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alquilsulfonila tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquila e a fração alquila do alquilsulfonila respectivamente têm
15 os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como metilsulfonilmetila e etilsulfonilmetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (haloalquil)-S- tendo 1 a 6 átomos de carbono, em
20 que a fração alquila e a fração haloalquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como difluorometiltiometila e trifluorometiltiometila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalquilsulfinil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a
25 menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (haloalquil)-SO- tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquila e a fração haloalquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como difluorometilsulfinilmetila e trifluorometilsulfinilmetila podem ser incluídos,

por exemplo.

O grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (haloalquil)-SO₂- tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquila e a fração haloalquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como difluorometilsulfonilmetila e trifluorometilsulfonilmetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo fenilalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono que é substituído por um grupo fenila, em que a fração alquila e a fração alcóxi respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como benziloximetila e benziloxietila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono que é substituído por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquila e a fração alcóxi respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-(2-metoxietóxi)etila e 2-(2-etoxietóxi)etila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo cicloalquilóxi C_3-C_8 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um (cicloalquil)-O- grupo tendo 3 a 8 átomos de carbono, em que a fração alquila e a fração cicloalquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como ciclopropiloximetila, ciclobutiloximetila, ciclopentiloximetila e cicloexiloximetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo fenilóxi alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (fenil)-O-, em que a fração alquila tem os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como fenoximetila, 2-fenoxietila e 3-fenoxipropila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo fenilto C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (fenil)-S-, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como feniltiometa, 2-feniltioetila e 3-feniltiopropila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalcóxi C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquil-O- de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por 1 a 13, e preferivelmente 1 a 5, átomos de halogênio idênticos ou diferentes, em que a fração haloalquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como clorometóxi, difluorometóxi, clorodifluorometóxi, trifluorometóxi e 2,2,2-trifluoretóxi podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo haloalcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração haloalcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como clorometoximetila, difluorometoximetila, clorodifluorometoximetila, trifluorometoximetila e 2,2,2-trifluoretometoximetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo haloalcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo haloalcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração haloalcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como clorometoximetóxi,

difluorometoximetóxi, clorodifluorometoximetóxi, trifluorometoximetóxi e 2,2,2-trifluoretoximetóxi podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquiltio C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono que é substituído por um grupo alquiltio tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquiltio, a fração alcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-metiltioetoximetila e 2-etiltioetoximetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquilsulfinil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono que é substituído por um grupo alquilsulfinila tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquilsulfinila, a fração alcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-metilsulfiniletoximetila e 2-etilsulfiniletoximetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono que é substituído por um grupo alquilsulfonila tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquilsulfonila, a fração alcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-metilsulfoniletoximetila e 2-etilsulfoniletoximetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo cianoalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono que é substituído por um grupo ciano, em que a fração alcóxi e a fração alquila

respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-cianoetoximetila e 3-cianopropoximetila podem ser incluídos, por exemplo.

5 O grupo cianoalquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo ciano, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como cianometila e 2-cianoetila podem ser incluídos, por exemplo.

10 O grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um (alquil)-C(=O)O- grupo tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como acetoximetila, propioniloximetila, isopropioniloximetila e pivaloiloximetila podem ser incluídos, por exemplo.

15 O grupo acil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo acila tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração acila e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-oxopropila, 3-oxopropila e 2-oxobutila podem ser incluídos, por exemplo.

20 O grupo di(alcóxi C_1-C_6) alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono dissustituídos com grupos alcóxi, cada um tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como (2,2-dimetóxi)etila, (3,3-dimetóxi)propila, (2,2-dietóxi)etila e (3,3-dietóxi)propila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alcoxycarbonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de

carbono substituídos por um grupo alcóxicarbonila tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-metóxi-2-oxoetila, 2-etóxi-2-oxoetila e 2-terc-butóxi-2-oxoetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alcoxiimino C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (alcóxi)-N= tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alcóxi e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2-metoxi-iminoetila e 3-metoxi-iminopropila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo arila C_6-C_{10} pode ser exemplificado por grupos, tais como fenila e naftila.

O grupo aril C_6-C_{10} alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo arila tendo 6 a 10 átomos de carbono, em que a fração arila e a fração alquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como benzila, fenetila, 3-fenilpropila, naftalen-1-ilmetila e naftalen-2-ilmetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo halocicloalquila C_3-C_8 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo cicloalquila tendo 3 a 8 átomos de carbono substituídos por 1 a 5, e preferivelmente 1 a 3, átomos de halogênio, em que a fração cicloalquila e o átomo de halogênio respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2,2-difluorciclopropila e 2,2-diclorociclopropila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo nitroalquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo nitro, em que a fração alquila tem o mesmo

significado definido anteriormente, e grupos, tais como nitrometila e 2-nitroetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo hidroxialquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo hidroxila, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-hidroxietila e 3-hidroxipropila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo acilamino C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo amino substituído com um grupo acila tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração acila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como formamida, acetamida e propionamida podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo $(R^6R^7N-C=O)$ alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por $(R^6R^7N-C=O)$, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como N,N -dimetilaminocarbonilmetila, N,N -dimetilaminocarboniletila e N -metil- N -etilaminocarbonilmetila podem ser incluídos, por exemplo.

A cadeia de alquilenos C_2-C_5 pode ser exemplificada, a menos que particularmente limitado, por grupos, tais como etileno, trimetileno, propileno, tetrametileno e pentametileno.

O grupo heterocíclico alquilóxi C_1-C_6 em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (heterocíclico)-O-, em que a fração alquila e a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio têm os mesmos significados definidos anteriormente,

e grupos, tais como 2-(2-piridilóxi)etila, 2-(2-pirazinilóxi)etila, e 2-(2-tiazolil)etila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo cicloalquil C_3-C_8 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo alcóxi tendo 1 a 6 átomos de carbono que é substituído por um grupo cicloalquila tendo 3 a 8 átomos de carbono, em que a fração alquila, a fração alcóxi e a fração cicloalquila respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como ciclopropilmetiloximetila, ciclobutilmetiloximetila, 10 ciclopentilmetiloximetila e cicloexilmetiloximetila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo fenilsulfinil alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (fenil)-SO-, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como fenilsulfinilmetila, 2- 15 fenilsulfiniletila, e 3-fenilsulfinilpropila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo fenilsulfonil alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo (fenil)-SO₂-, em que a fração alquila tem o mesmo significado definido anteriormente, e grupos, tais como 2-fenilsulfoniletila, 3- 20 fenilsulfonilpropila, e 4-fenilsulfonilbutila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquilideno C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila divalente de cadeia reta ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, e grupos, tais como metileno, 25 etilideno, propilideno, e isopropilidene podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo alquilidenoaminóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um (alquilideno)=N-O- tendo 1 a 6 átomos de carbono, em que a fração alquiliden e a fração alquila respectivamente têm os

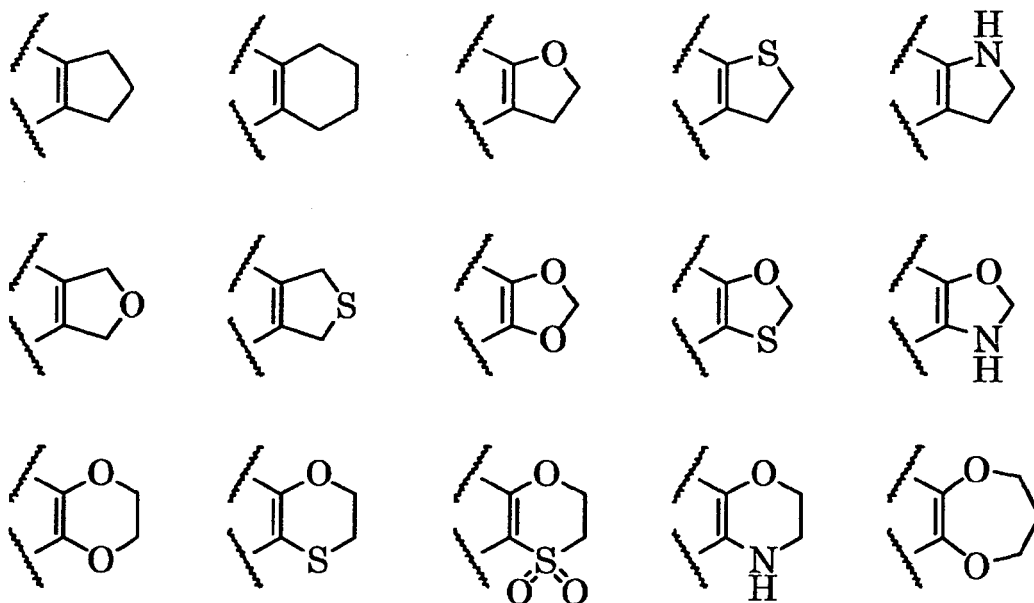
mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como metilenoaminoximetila, 2-(etilidenoaminoxí)etila, e 2-(isopropilideneaminoxí)etila podem ser incluídos, por exemplo.

O grupo halocicloalquil C₃-C₈ alquila C₁-C₆ representa, a menos que particularmente limitado, um grupo alquila tendo 1 a 6 átomos de carbono substituídos por um grupo cicloalquila tendo 3 a 8 átomos de carbono que é substituído por 1 a 5, preferivelmente 1 a 3 átomos de halogênio, em que a fração cicloalquila, a fração alquila, e o átomo de halogênio respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente, e grupos, tais como 2,2-difluorociclopropilmetila, e 2,2-diclorociclopropilmetila podem ser incluídos, por exemplo.

O metal alcalino pode ser exemplificado por sódio, potássio e similares.

As frases “dois R² adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais eles são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros, ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio,” “dois R¹² adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais eles são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros, ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio,” e “dois R¹³ adjacentes podem ser unidos com os respectivos átomos de carbono aos quais eles são diretamente ligados para formar um anel carbocíclico de 4 a 8 membros, ou um anel heterocíclico de 4 a 8 membros tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio,” pode ser exemplificado pelo seguinte, a menos que particularmente limitado.

[Fórmula química 5]



X^1 na fórmula [I] da presente invenção pode ser exemplificado por um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre. Um X^1 preferido inclui um átomo de oxigênio. Com relação à fórmula [I], X^1 é descrito na forma de grupo carbonila; entretanto, no caso onde o substituinte R^1 no átomo de nitrogênio adjacente é tal como um átomo de hidrogênio, X^1 não está na forma de carbonila, mas pode existir na forma de enol, que é um tautômero da forma carbonila.

X^2 na fórmula [I] da presente invenção representa $=CH-$ ou $=N(O)_m-$ (desde que m represente um número inteiro de 0 ou 1). Quando X^2 é $=CH-$, o anel de 6 membros contendo X^2 volta a ser um anel de benzeno que é fundido com um anel de pirazina, para assim formar um anel de benzopirazina. O anel de benzeno assim formado pode ser substituído por um substituinte R^2 na posição de X^2 , como é o caso para os outros átomos de carbono no anel de benzeno. No presente pedido de patente, isto é expresso de maneira tal que “o átomo de carbono pode ser substituído por R^2 .” Além disso, quando X^2 representa $=N(O)_m-$, isto é, $=N-$ ou $=N(O)-$, o anel de 6 membros contendo X^2 volta a ser um anel de piridina ou um anel de N-óxido de piridina que é fundido com um anel de pirazina, para assim formar um anel

de piridopirazina ou um anel de N-óxido deste. X^2 preferido na fórmula [I] da presente invenção inclui $=CH-$, $=C(R^2)-$, ou $=N-$.

R^1 na fórmula [I] da presente invenção pode ser exemplificado por um átomo de hidrogênio; um grupo alquila C_1-C_{12} ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo cicloalquil C_3-C_8 alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquenila C_2-C_6 ; um grupo haloalquinila C_2-C_6 ; um grupo aminoalquila C_1-C_6 ; um grupo nitroalquila C_1-C_6 ; um grupo mono(alquil C_1-C_6) aminoalquila C_1-C_6 ; um grupo di(alquil C_1-C_6) aminoalquila C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfinil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfinil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo hidroxialquila C_1-C_6 ; um grupo fenilalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 (a fração fenila do grupo pode ser substituída por um ou dois ou mais R^4 idênticos ou diferentes); um grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cicloalquilóxi C_3-C_8 alquila C_1-C_6 ; um grupo fenilóxi alquila C_1-C_6 (a fração fenila do grupo pode ser substituída por um ou dois ou mais R^4 idênticos ou diferentes); um grupo feniltop C_1-C_6 (a fração fenila do grupo pode ser substituída por um ou dois ou mais R^4 idênticos ou diferentes); um grupo haloalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo heterocíclico alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio no grupo, pode ser substituído por um ou dois ou mais R^5 idênticos ou diferentes); um grupo alquiltio C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfinil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalcóxi

C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalquila C_1-C_6 ; um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo acil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo di(alcóxi C_1-C_6) alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxicarbonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcoxiiimino C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo ($R^6R^7N-C=O$) alquila C_1-C_6 ; um grupo aril C_6-C_{10} alquila C_1-C_6 (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^8 idênticos ou diferentes que será descrita posteriormente); um grupo alquila C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio no grupo, pode ser substituído por um ou dois ou mais R^9 idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente); um grupo $NR^{10}R^{11}$; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo arila C_6-C_{10} (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{12} idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente); ou um grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{13} idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente).

Exemplos preferidos de R^1 incluem um átomo de hidrogênio; um grupo alquila C_1-C_{12} ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquenila C_2-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo fenilóxi alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo tetraidrofurano alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonil C_1-C_6 alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo cianoalquila C_1-C_6 ;

um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo acil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo alcoxycarbonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo (R⁶R⁷N-C=O) alquila C₁-C₆; um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁸ idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente); um grupo alquila C₁-C₆ heterocíclico (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁹ idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente); um grupo NR¹⁰R¹¹; um grupo arila C₆-C₁₀ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente); um grupo heterocíclico (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente); e similares. Exemplos mais preferidos de R¹ incluem um grupo alquila C₁-C₁₂, um grupo alquenila C₂-C₆, um grupo alquinila C₂-C₆, um grupo cicloalquila C₃-C₈, um grupo haloalquila C₁-C₆, um grupo haloalquenila C₂-C₆, um grupo alquiltio C₁-C₆ alquila C₁-C₆, um grupo alquilsulfonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆, um grupo alcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆, um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆, um grupo tetraidrofurano alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆, um grupo cianoalquila C₁-C₆, um grupo alcoxycarbonil C₁-C₆ alquila C₁-C₆, um grupo aril C₆-C₁₀ alquila C₁-C₆ (a fração arila do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁸ idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente), um grupo alquila C₁-C₆ heterocíclico (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R⁹ idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente), um grupo arila C₆-C₁₀ (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹² idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente), um grupo heterocíclico (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹³ idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente); e similares.

R² na fórmula [I] da presente invenção pode ser exemplificado por um átomo de halogênio; um grupo hidroxila; um grupo nitro; um grupo

ciano; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo cicloalquila C_3-C_8 ; um grupo cicloalquil C_3-C_8 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquenila C_2-C_6 ; um grupo alquinila C_2-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um C_1-C_8 halociclogrupo alquila; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo cicloalquilóxi C_3-C_8 ; um grupo alquenilóxi C_2-C_6 ; um grupo alquinilóxi C_2-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfinila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo haloalquiltio C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfinila C_1-C_6 ; um grupo haloalquilsulfonila C_1-C_6 ; um grupo amino; um grupo mono(alquil C_1-C_6) amino; um grupo di(alquil C_1-C_6) amino; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo acila C_1-C_6 ; um grupo alcoxiimino C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo carboxila; um grupo alcoxycarbonila C_1-C_6 ; um grupo mono(alquil C_1-C_6) aminocarbonila; um grupo di(alquil C_1-C_6) aminocarbonila; um grupo alquila C_1-C_6 heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio; e similares.

Exemplos preferidos de R^2 incluem um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 alquila C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; e similares.

Exemplos mais preferidos de R^2 include um átomo de halogênio; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquiltio C_1-C_6 ; um grupo alquilsulfonila C_1-C_6 ; e similares, e ainda mais preferivelmente, um átomo de halogênio; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; e um grupo alcóxi C_1-C_6 .

n na fórmula [I] da presente invenção é um número inteiro de 0 a 4 (desde que quando X^2 é $N(O)_m$, um número inteiro de 0 a 3), preferivelmente 0 a 2, e mais preferivelmente 0 a 1.

R^3 na fórmula [I] da presente invenção pode ser exemplificado por um grupo hidroxila; $O-M^+$ (M^+ representa um cátion de metal alcalino ou

um cátion amônio); um grupo amino; um átomo de halogênio; um grupo alquilsulfonilóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfinila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆; um grupo alqueniltio C₂-C₆; um grupo alquenilsulfinil C₂-C₆; um grupo alquenilsulfonil C₂-C₆; um grupo alquiniltio C₂-C₆; um grupo alquinilsulfinila C₂-C₆; um grupo alquinilsulfonila C₂-C₆; um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆; um grupo alquenilcarbonilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilcarbonilóxi C₂-C₆; um grupo fenóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ idênticos ou diferentes); um grupo feniltio (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ diferentes); um grupo fenilsulfinila (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ diferentes); um grupo fenilsulfonila (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ diferentes); um grupo fenilsulfonilóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ diferentes); um grupo fenilcarbonilóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ diferentes); um grupo 1,2,4-triazol-1-ila; um grupo 1,2,3-triazol-1-ila; um grupo 1,2,3-triazol-2-ila; grupo um imidazol-1-ila; um grupo pirazol-1-ila; um grupo tetrazol-1-ila; um grupo tetrazol-2-ila; e similares. Um exemplo preferido de R³ inclui um grupo hidroxila, e derivados, tais como sais, éteres e ésteres destes grupos também podem ser empregados.

Um exemplo acima de tudo preferido de R³ inclui um grupo hidroxila.

R⁸ na fórmula [I] da presente invenção pode ser exemplificado por um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo alquenilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilóxi C₂-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfinila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo

haloalquilsulfinila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆; um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆; um grupo acila C₁-C₆; ou um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆. Exemplos preferidos de R⁸ incluem um átomo de halogênio; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; e similares.

R⁹ na fórmula [I] da presente invenção pode ser exemplificado por um grupo oxo; um átomo de halogênio; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo alquenilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilóxi C₂-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfinila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆; um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆; um grupo acila C₁-C₆; ou um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆.

Exemplos preferidos de R⁹ incluem um grupo alquila C₁-C₆; um átomo de halogênio; um grupo haloalquila C₁-C₆ e similares.

R¹² na fórmula [I] da presente invenção pode ser exemplificado por um átomo de halogênio; um grupo hidroxila; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo cicloalquil C₃-C₈ alquila C₁-C₆; um grupo alquenila C₂-C₆; um grupo alquinila C₂-C₆; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆; um grupo cicloalquilóxi C₃-C₈; um grupo alquenilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilóxi C₂-C₆; um grupo alquilcarbonilóxi C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfinila C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfinila C₁-C₆; um grupo haloalquilsulfonila C₁-C₆; um grupo amina; um grupo acilamina C₁-C₆; um grupo mono(alquil C₁-C₆) amina; um grupo di(alquil C₁-C₆) amina; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo

alcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆; um grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilóxi C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆; um grupo cianoalcóxi C₁-C₆; um grupo acila C₁-C₆; um grupo alcoxiimino C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo carboxila; um grupo alcoxycarbonila C₁-C₆; um grupo carbamoíla; um grupo

5 mono(alquil C₁-C₆) aminocarbonila; um grupo di(alquil C₁-C₆) aminocarbonila; um grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica do grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ idênticos ou diferentes que serão

10 descritos posteriormente); um grupo alcóxi C₁-C₆ heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio (a fração heterocíclica tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e

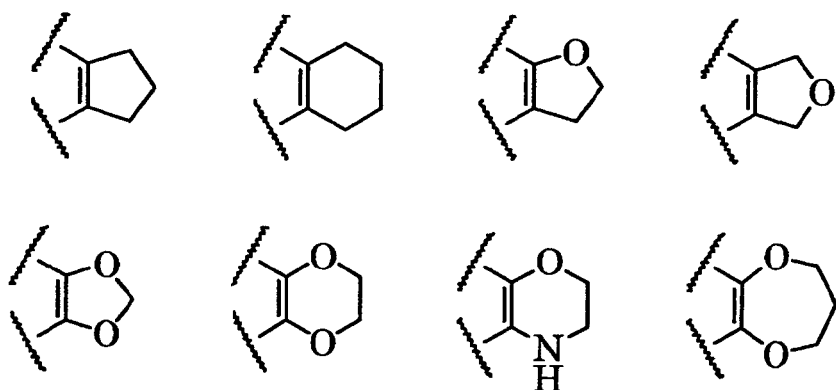
15 um átomo de nitrogênio, pode ser substituído por um ou dois ou mais R¹⁴ idênticos ou diferentes que serão descritos posteriormente); e similares.

Exemplos preferidos de R¹² incluem um átomo de halogênio; um grupo hidroxila; um grupo nitro; um grupo ciano; um grupo alquila C₁-C₆; um grupo cicloalquila C₃-C₈; um grupo haloalquila C₁-C₆; um grupo alcóxi

20 C₁-C₆; um grupo alquenilóxi C₂-C₆; um grupo alquinilóxi C₂-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆; um grupo alquiltio C₁-C₆; um grupo alquilsulfonila C₁-C₆; um grupo haloalquiltio C₁-C₆; um grupo alcóxi C₁-C₆ alquila C₁-C₆; um grupo cicloalquil C₃-C₈ alquilóxi C₁-C₆; um grupo haloalcóxi C₁-C₆ alcóxi C₁-C₆; um grupo cianoalcóxi C₁-C₆; um grupo acila C₁-C₆; um grupo alcoxycarbonila

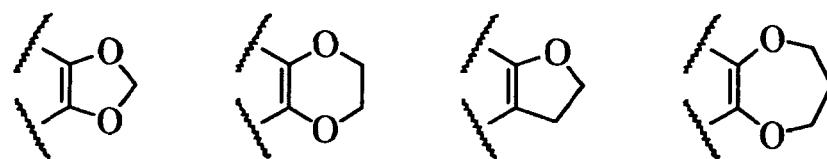
25 C₁-C₆; um grupo di(alquil C₁-C₆) amino; um grupo alcóxi C₁-C₆ heterocíclico; e os mostrados a seguir.

[Fórmula química 6]



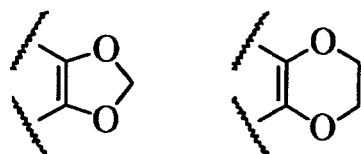
Exemplos mais preferidos de R^{12} incluem um átomo de halogênio; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo alquenilóxi C_2-C_6 ; um grupo alquinilóxi C_2-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ; um grupo acila C_1-C_6 ; e os mostrados a seguir.

[Fórmula química 7]



5 Exemplos acima de tudo preferidos destes incluem um átomo de halogênio; um grupo alquila C_1-C_6 ; um grupo haloalquila C_1-C_6 ; um grupo alcóxi C_1-C_6 ; um grupo haloalcóxi C_1-C_6 ; e os mostrados a seguir.

[Fórmula química 8]



A^1 na fórmula [I] da presente invenção representa $-C(R^{15}R^{16})-$.

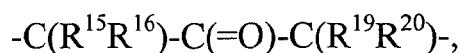
A^2 na fórmula [I] da presente invenção representa $-C(R^{17}R^{18})-$

10 ou $C=O$.

A^3 na fórmula [I] da presente invenção representa $-C(R^{19}R^{20})-$.

Isto é, $-A^1-A^2-A^3-$ na fórmula [I] da presente invenção representa:

$-C(R^{15}R^{16})-C(R^{17}R^{18})-C(R^{19}R^{20})-$ ou



e eles formam um anel carbocíclico de 6 membros junto com átomos de carbono adjacentes.

R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} e R^{20} aqui usados cada um independentemente incluem um átomo de hidrogênio; ou um grupo alquila $\text{C}_1\text{-C}_6$. Além disso, R^{15} e R^{20} podem ser unidos com átomos de carbono adjacentes para formar um anel carbocíclico de 5 a 10 membros e preferivelmente de 5 a 8 membros. Em outras palavras, R^{15} e R^{20} podem ser unidos para formar um cadeia de alquilenos $\text{C}_2\text{-C}_5$ divalente de cadeia reta ou ramificada. Um grupo alquilenos preferido pode ser exemplificado por um grupo etileno.

Exemplos específicos do grupo heterocíclico da forma indicada no “grupo heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos arbitrariamente selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio,” “grupo heterocíclico alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ alquila $\text{C}_1\text{-C}_6$ em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio,” “grupo alquila $\text{C}_1\text{-C}_6$ heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio,” ou “grupo alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ heterocíclico em que a fração heterocíclica tem 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos arbitrariamente selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio,” include tetraidrofurano, tetraidrotiofeno, dióxido de tetraidrotiofeno, tetraidrotiopirano, dióxido de tetraidrotiopirano, 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 2,3-diidrobenzofurano, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano, benzofurano, indol e similares.

Um grupo de exemplos preferidos do anel heterocíclico inclui 4,5-diidroisoxazol, tiofeno, pirazol, oxazol, isoxazol, tiazol, isotiazol, piridina, pirazina, 1,3-benzodioxol, e benzo-1,4-dioxano. Exemplos mais preferidos do anel heterocíclico incluem tiofeno, isoxazol, piridina, 1,3-benzodioxol, benzo-1,4-dioxano e similares.

O grupo heterocíclico formado do anel heterocíclico mostrado na fórmula [I] da presente invenção pode ser preparado em um radical sendo anexado em qualquer posição de um anel heterocíclico selecionado. Mesmo no caso onde o anel heterocíclico selecionado é um anel fundido com um anel de benzeno, em cuja posição o radical formado não é limitado à fração heterocíclica, e uma posição no anel de benzeno também pode ser selecionada.

Exemplos específicos preferidos do composto representado pela fórmula [I] da presente invenção serão mostrados nas seguintes tabelas 1 a tabela 45. Entretanto, o composto da presente invenção não se destina a limitar estes compostos. Adicionalmente, os números do composto serão referidos nas seguintes descrições.

As seguintes notações nas tabelas no presente pedido de patente representam os respectivos grupos correspondentes indicados a seguir.

Por exemplo,

Me representa um grupo metila,

Et representa um grupo etila,

n-Pr representa um grupo n-propila,

i-Pr representa um grupo isopropila,

c-Pr representa um grupo ciclopropila,

n-Bu representa um grupo n-butila,

s-Bu representa um grupo sec-butila,

i-Bu representa um grupo isobutila,

t-Bu representa um grupo terc-butila,

c-Bu representa um grupo ciclobutila,

n-Pen representa um grupo n-pentila,

c-Pen representa um grupo ciclopentila,

n-Hex representa um grupo n-hexila,

5 Ph representa um grupo fenila,

Bn representa um grupo benzila,

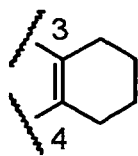
“-” para R^2 e R^{12} implica que eles são não substituídos,

(4-Cl)Bn representa um grupo 4-clorobenzila,

3,4-(CH₂CH₂CH₂CH₂)- representa a seguinte estrutura química

10 em que a posição 3 e a posição 4 são ligados pelo grupo butileno para formar um anel:

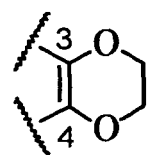
[Fórmula química 9]



e 3,4-(OCH₂CH₂O)- representa a seguinte estrutura química

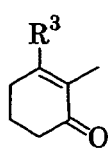
em que a posição 3 e a posição 4 são similarmente ligadas pelo grupo etilenodióxi para formar um anel:

[Fórmula química 10]

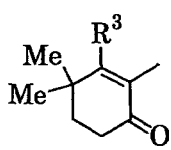


15 Além disso, com relação a A nas tabelas, A-1, A-2, A-3, A-4, A-5, A-6 e A-7 respectivamente representam os seguintes grupos.

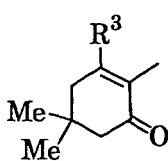
[Fórmula química 11]



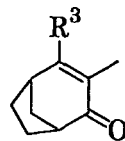
A-1



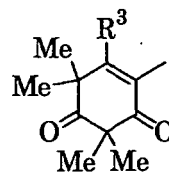
A-2



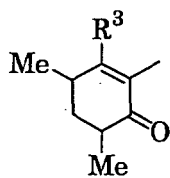
A-3



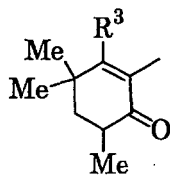
A-4



A-5



A-6



A-7

Tabela 1

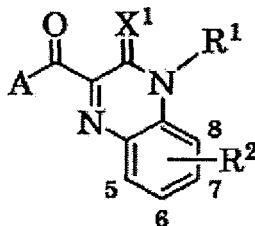
					
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-1	A-1	O	H	—	OH
I-2	A-1	O	Me	—	OH
I-3	A-2	O	Me	—	OH
I-4	A-3	O	Me	—	OH
I-5	A-4	O	Me	—	OH
I-6	A-5	O	Me	—	OH
I-7	A-1	O	Et	—	OH
I-8	A-2	O	Et	—	OH
I-9	A-3	O	Et	—	OH
I-10	A-4	O	Et	—	OH
I-11	A-5	O	Et	—	OH
I-12	A-1	O	n-Pr	—	OH
I-13	A-1	O	i-Pr	—	OH
I-14	A-1	O	c-Pr	—	OH
I-15	A-1	O	n-Bu	—	OH
I-16	A-1	O	s-Bu	—	OH
I-17	A-1	O	i-Bu	—	OH
I-18	A-1	O	t-Bu	—	OH
I-19	A-1	O	c-Bu	—	OH
I-20	A-1	O	n-Pen	—	OH
I-21	A-1	O	c-Pen	—	OH
I-22	A-1	O	n-Hex	—	OH
I-23	A-1	O	c-Hex	—	OH
I-24	A-1	O	n-C ₇ H ₁₅	—	OH
I-25	A-1	O	n-C ₈ H ₁₇	—	OH
I-26	A-1	O	n-C ₉ H ₁₉	—	OH
I-27	A-1	O	n-C ₁₀ H ₂₁	—	OH
I-28	A-1	O	n-C ₁₁ H ₂₃	—	OH
I-29	A-1	O	n-C ₁₂ H ₂₅	—	OH
I-30	A-1	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
I-31	A-2	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
I-32	A-3	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
I-33	A-4	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH

Tabela 2

Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-34	A-5	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
I-35	A-1	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
I-36	A-2	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
I-37	A-3	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
I-38	A-4	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
I-39	A-5	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
I-40	A-1	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
I-41	A-2	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
I-42	A-3	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
I-43	A-4	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
I-44	A-5	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
I-45	A-1	O	CH ₂ CH ₂ F	—	OH
I-46	A-1	O	CH ₂ CH ₂ Cl	—	OH
I-47	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CF ₃	—	OH
I-48	A-1	O	CH ₂ CH=CCl ₂	—	OH
I-49	A-1	O	CH ₂ OMe	—	OH
I-50	A-1	O	CH ₂ OEt	—	OH
I-51	A-2	O	CH ₂ OEt	—	OH
I-52	A-3	O	CH ₂ OEt	—	OH
I-53	A-4	O	CH ₂ OEt	—	OH
I-54	A-5	O	CH ₂ OEt	—	OH
I-55	A-1	O	CH(Me)OMe	—	OH
I-56	A-1	O	CH(Me)OEt	—	OH
I-57	A-1	O	CH ₂ OPh	—	OH
I-58	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
I-59	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
I-60	A-2	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
I-61	A-3	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
I-62	A-4	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
I-63	A-5	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
I-64	A-1	O	CH(Me)OCH ₂ CF ₃	—	OH
I-65	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ 	—	OH
I-66	A-1	O	CH(Me)OCH ₂ 	—	OH
I-67	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
I-68	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	—	OH
I-69	A-1	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	—	OH
I-70	A-1	O	CH ₂ SMe	—	OH

Tabela 3

Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-71	A-4	O	CH ₂ SMe	—	OH
I-72	A-1	O	CH ₂ SEt	—	OH
I-73	A-1	O	CH ₂ S·n·Pr	—	OH
I-74	A-1	O	CH(Me)SMe	—	OH
I-75	A-1	O	CH(Me)SEt	—	OH
I-76	A-1	O	CH(Me)S·n·Pr	—	OH
I-77	A-1	O	CH ₂ SOMe	—	OH
I-78	A-1	O	CH ₂ SOEt	—	OH
I-79	A-1	O	CH ₂ SO·n·Pr	—	OH
I-80	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
I-81	A-4	O	CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
I-82	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Et	—	OH
I-83	A-1	O	CH ₂ SO ₂ ·n·Pr	—	OH
I-84	A-1	O	CH(Me)SO ₂ Me	—	OH
I-85	A-1	O	CH(Me)SO ₂ Et	—	OH
I-86	A-1	O	CH(Me)SO ₂ ·n·Pr	—	OH
I-87	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OH	—	OH
I-88	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
I-89	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OEt	—	OH
I-90	A-1	O	CH(Me)CH ₂ OMe	—	OH
I-91	A-1	O	CH ₂ CH ₂ SMe	—	OH
I-92	A-1	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
I-93	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
I-94	A-1	O	CH ₂ C(=O)Me	—	OH
I-95	A-1	O	CH ₂ C(=O)OMe	—	OH
I-96	A-1	O	CH ₂ C(=O)OEt	—	OH
I-97	A-1	O	CH ₂ C(=O)O·n·Pr	—	OH
I-98	A-1	O	CH ₂ C(=O)O·i·Pr	—	OH
I-99	A-1	O	CH ₂ C(=O)O·t·Bu	—	OH
I-100	A-1	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	—	OH
I-101	A-1	O	CH ₂ C(=O)—N 	—	OH
I-102	A-1	O	CH ₂ CN	—	OH
I-103	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CN	—	OH
I-104	A-1	O	CH(Me)CH ₂ CN	—	OH
I-105	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	—	OH
I-106	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NO ₂	—	OH
I-107	A-1	O	Bn	—	OH
I-108	A-1	O	(2-F)Bn	—	OH

Tabela 4

Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-109	A-1	O	(3-F)Bn	—	OH
I-110	A-1	O	(4-F)Bn	—	OH
I-111	A-1	O	(2-Cl)Bn	—	OH
I-112	A-1	O	(3-Cl)Bn	—	OH
I-113	A-1	O	(4-Cl)Bn	—	OH
I-114	A-1	O	(2-Me)Bn	—	OH
I-115	A-1	O	(3-Me)Bn	—	OH
I-116	A-1	O	(4-Me)Bn	—	OH
I-117	A-1	O	(2-CF ₃)Bn	—	OH
I-118	A-1	O	(3-CF ₃)Bn	—	OH
I-119	A-1	O	(4-CF ₃)Bn	—	OH
I-120	A-1	O	(2-OMe)Bn	—	OH
I-121	A-2	O	(2-OMe)Bn	—	OH
I-122	A-3	O	(2-OMe)Bn	—	OH
I-123	A-4	O	(2-OMe)Bn	—	OH
I-124	A-5	O	(2-OMe)Bn	—	OH
I-125	A-1	O	(3-OMe)Bn	—	OH
I-126	A-1	O	(4-OMe)Bn	—	OH
I-127	A-1	O	(2,4-(OMe) ₂)Bn	—	OH
I-128	A-1	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	—	OH
I-129	A-1	O	(3,5-(OMe) ₂)Bn	—	OH
I-130	A-1	O	CH(Me)Ph	—	OH
I-131	A-1	O		—	OH
I-132	A-2	O		—	OH
I-133	A-3	O		—	OH
I-134	A-4	O		—	OH
I-135	A-5	O		—	OH
I-136	A-1	O		—	OH
I-137	A-1	O		—	OH
I-138	A-1	O		—	OH

Tabela 5

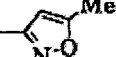
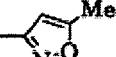
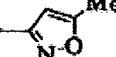
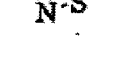
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-139	A-1	O		—	OH
I-140	A-2	O		—	OH
I-141	A-3	O		—	OH
I-142	A-4	O		—	OH
I-143	A-5	O		—	OH
I-144	A-1	O		—	OH
I-145	A-1	O		—	OH
I-146	A-2	O		—	OH
I-147	A-3	O		—	OH
I-148	A-4	O		—	OH
I-149	A-5	O		—	OH
I-150	A-1	O		—	OH
I-151	A-1	O		—	OH
I-152	A-1	O		—	OH
I-153	A-1	O		—	OH
I-154	A-1	O		—	OH

Tabela 6

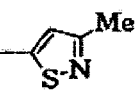
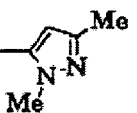
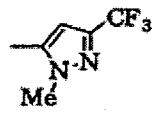
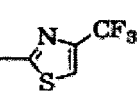
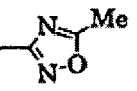
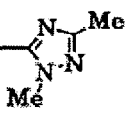
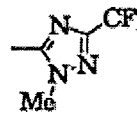
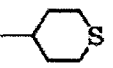
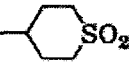
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-155	A-1	O		—	OH
I-156	A-1	O		—	OH
I-157	A-1	O		—	OH
I-158	A-1	O		—	OH
I-159	A-1	O		—	OH
I-160	A-1	O		—	OH
I-161	A-1	O		—	OH
I-162	A-1	O		—	OH
I-163	A-1	O		—	OH
I-164	A-1	O		—	OH
I-165	A-1	O		—	OH
I-166	A-1	O		—	OH
I-167	A-1	O		—	OH
I-168	A-1	O		—	OH

Tabela 7

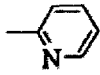
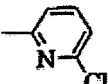
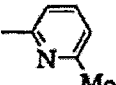
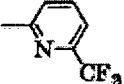
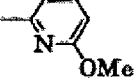
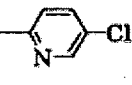
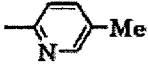
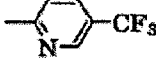
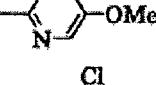
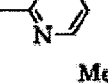
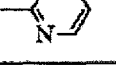
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-169	A-1	O		—	OH
I-170	A-1	O		—	OH
I-171	A-1	O		—	OH
I-172	A-1	O		—	OH
I-173	A-1	O		—	OH
I-174	A-1	O		—	OH
I-175	A-1	O		—	OH
I-176	A-1	O		—	OH
I-177	A-1	O		—	OH
I-178	A-1	O		—	OH
I-179	A-1	O		—	OH
I-180	A-1	O		—	OH
I-181	A-1	O		—	OH
I-182	A-1	O		—	OH

Tabela 8

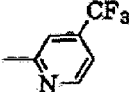
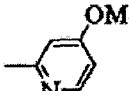
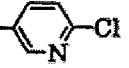
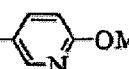
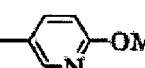
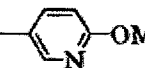
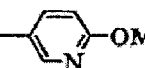
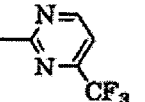
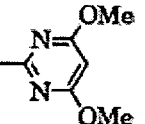
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-183	A-1	O		—	OH
I-184	A-1	O		—	OH
I-185	A-1	O		—	OH
I-186	A-1	O		—	OH
I-187	A-1	O		—	OH
I-188	A-1	O		—	OH
I-189	A-1	O		—	OH
I-190	A-2	O		—	OH
I-191	A-3	O		—	OH
I-192	A-4	O		—	OH
I-193	A-5	O		—	OH
I-194	A-1	O		—	OH
I-195	A-1	O		—	OH
I-196	A-1	O		—	OH
I-197	A-1	O		—	OH

Tabela 9

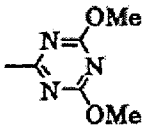
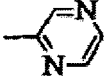
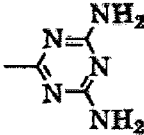
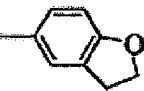
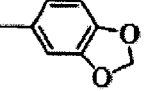
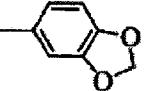
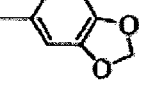
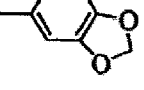
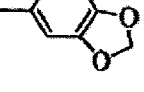
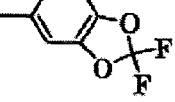
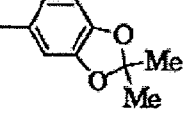
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-198	A-1	O		—	OH
I-199	A-1	O		—	OH
I-200	A-1	O		—	OH
I-201	A-1	O		—	OH
I-202	A-1	O		—	OH
I-203	A-2	O		—	OH
I-204	A-3	O		—	OH
I-205	A-4	O		—	OH
I-206	A-5	O		—	OH
I-207	A-1	O		—	OH
I-208	A-1	O		—	OH

Tabela 10

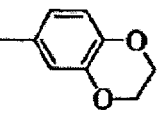
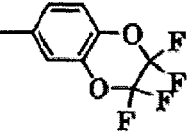
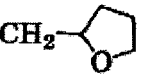
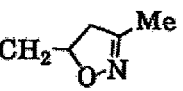
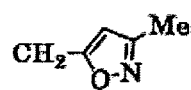
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-209	A-1	O		—	OH
I-210	A-1	O		—	OH
I-211	A-1	O		—	OH
I-212	A-1	O		—	OH
I-213	A-1	O		—	OH
I-214	A-1	O	NH ₂	—	OH
I-215	A-1	O	NHMe	—	OH
I-216	A-1	O	NMe ₂	—	OH
I-217	A-1	O	OMe	—	OH
I-218	A-1	O	OEt	—	OH
I-219	A-1	O	Me	5-F	OH
I-220	A-1	O	Me	6-F	OH
I-221	A-1	O	Me	7-F	OH
I-222	A-1	O	Me	8-F	OH
I-223	A-1	O	Me	5-Cl	OH
I-224	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	5-Cl	OH
I-225	A-1	O	Me	6-Cl	OH
I-226	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	6-Cl	OH
I-227	A-1	O	Me	7-Cl	OH
I-228	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	7-Cl	OH
I-229	A-1	O	Me	8-Cl	OH
I-230	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	8-Cl	OH
I-232	A-1	O	Me	7-Me	OH
I-233	A-1	O	Me	6-CF ₃	OH
I-234	A-1	O	Me	7-CF ₃	OH
I-235	A-1	O	Me	6-OH	OH
I-236	A-1	O	Me	7-OH	OH

Tabela 11

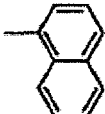
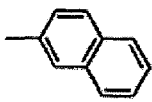
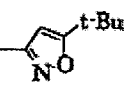
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-237	A-1	O	Me	6-OMe	OH
I-238	A-1	O	Me	7-OMe	OH
I-239	A-1	O	Me	6-OCF ₃	OH
I-240	A-1	O	Me	7-OCF ₃	OH
I-241	A-1	O	Me	5-SMe	OH
I-242	A-1	O	Me	6-SMe	OH
I-243	A-1	O	Me	7-SMe	OH
I-244	A-1	O	Me	8-SMe	OH
I-245	A-1	O	Me	5-SO ₂ Me	OH
I-246	A-1	O	Me	6-SO ₂ Me	OH
I-247	A-1	O	Me	7-SO ₂ Me	OH
I-248	A-1	O	Me	8-SO ₂ Me	OH
I-249	A-1	O	Me	6-NO ₂	OH
I-250	A-1	O	Me	7-NO ₂	OH
I-251	A-1	O	Me	6-NH ₂	OH
I-252	A-1	O	Me	7-NH ₂	OH
I-253	A-1	O	Me	7-CN	OH
I-254	A-1	O	Me	6,7-Cl ₂	OH
I-255	A-1	O	Me	6,7-Me ₂	OH
I-256	A-1	S	Me	—	OH
I-257	A-4	O	Me	—	S(n-Hex)
I-258	A-4	O	Me	—	SO(n-Hex)
I-259	A-4	O	Me	—	SO ₂ (n-Hex)
I-260	A-4	O	Me	—	SPh
I-261	A-4	O	Me	—	SOPh
I-262	A-4	O	Me	—	SO ₂ Ph
I-263	A-1	O		—	OH
I-264	A-1	O		—	OH
I-265	A-1	O		—	OH

Tabela 12

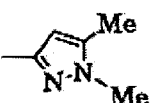
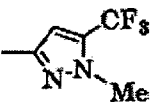
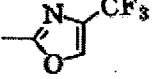
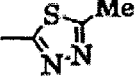
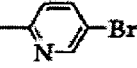
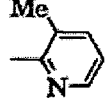
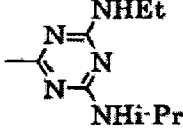
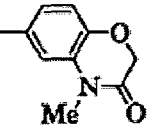
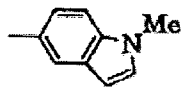
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-266	A-1	O		—	OH
I-267	A-1	O		—	OH
I-268	A-1	O		—	OH
I-269	A-1	O		—	OH
I-270	A-1	O		—	OH
I-271	A-1	O		—	OH
I-272	A-1	O		—	OH
I-273	A-1	O		—	OH
I-274	A-1	O		—	OH
I-275	A-1	O		—	OH
I-276	A-1	O		—	OH

Tabela 13

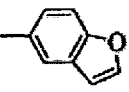
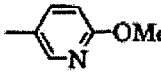
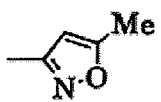
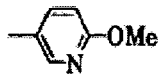
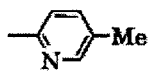
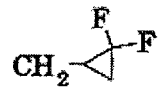
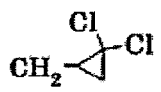
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-277	A-1	O		—	OH
I-278	A-1	O	N(Me)C(=O)Ot-Bu	—	OH
I-279	A-1	O		5-F	OH
I-280	A-1	O	Bn	6-F	OH
I-281	A-1	O		6-F	OH
I-282	A-1	O	Me	5-CH ₂ OMe	OH
I-283	A-1	O		5,7-F ₂	OH
I-284	A-1	O		7-Cl	OH
I-285	A-1	O	CH ₂ -c-Pr	—	OH
I-286	A-1	O	CH ₂ -c-Bu	—	OH
I-287	A-1	O	CH ₂ -c-Pen	—	OH
I-288	A-1	O	CH ₂ O-c-Pen	—	OH
I-289	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NH ₂	—	OH
I-290	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NHEt	—	OH
I-291	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	—	OH
I-292	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NEt ₂	—	OH
I-293	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CHO	—	OH
I-294	A-1	O		—	OH
I-295	A-1	O		—	OH
I-296	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ -c-Pr	—	OH
I-297	A-1	O	CH ₂ SPh	—	OH
I-298	A-1	O	CH ₂ CH ₂ O- 	—	OH

Tabela 14

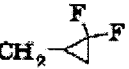
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-299	A-1	O	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	—	OH
I-300	A-1	O	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	—	OH
I-301	A-1	O	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	—	OH
I-302	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph	—	OH
I-303	A-1	O	CH ₂ SOPh	—	OH
I-304	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Ph	—	OH
I-305	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SMe	—	OH
I-306	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SOMe	—	OH
I-307	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂	—	OH
I-308	A-1	O	CH ₃ C(Me)=NOMe	—	OH
I-309	A-1	O	CH ₂ CH ₂ ON=CMe ₂	—	OH
I-310	A-1	O	Me	7-CH=CMe ₂	OH
I-311	A-1	O	Me	7-C≡CMe	OH
I-312	A-1	O	Me	7-CH ₂ -c-Pr	OH
I-313	A-1	O	Me	7-C(Me)=CF ₂	OH
I-314	A-1	O	Me	7- 	OH
I-315	A-1	O	Me	7-O-c-Pr	OH
I-316	A-1	O	Me	7- 	OH
I-317	A-1	O	Me	7-OCH ₂ -c-Pr	OH
I-318	A-1	O	Me	7-OCH ₂ OMe	OH
I-319	A-1	O	Me	7-OC(=O)Me	OH
I-320	A-1	O	Me	7-SOMe	OH
I-321	A-1	O	Me	7-SCF ₃	OH
I-322	A-1	O	Me	7-SOCH ₂ CF ₃	OH
I-323	A-1	O	Me	7-SO ₂ CH ₂ CF ₃	OH
I-324	A-1	O	Me	7-NMe ₂	OH
I-325	A-1	O	Me	7-NHC(=O)Me	OH
I-326	A-1	O	Me	7-CH ₂ OH	OH
I-327	A-1	O	Me	7-CH(OEt) ₂	OH
I-328	A-1	O	Me	7-CH ₂ SMe	OH
I-329	A-1	O	Me	7-CH ₂ SOMe	OH
I-330	A-1	O	Me	7-CH ₂ SO ₂ Me	OH
I-331	A-1	O	Me	7-CH ₂ SCHF ₂	OH
I-332	A-1	O	Me	7-CH ₂ SOCHF ₂	OH
I-333	A-1	O	Me	7-CH ₂ SO ₂ CHF ₂	OH

Tabela 15

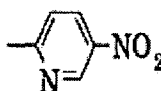
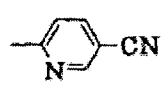
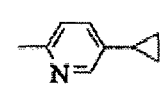
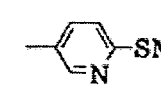
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-334	A-1	O	Me	7-CH ₂ CN	OH
I-335	A-1	O	Me	7-C(Me)=NOMe	OH
I-336	A-1	O	Me	7-C(=O)NH ₂	OH
I-337	A-1	O	Me	7- 	OH
I-338	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-F)	—	OH
I-339	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-Cl)	—	OH
I-340	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-NO ₂)	—	OH
I-341	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CN)	—	OH
I-342	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-Me)	—	OH
I-343	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CF ₃)	—	OH
I-344	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-OMe)	—	OH
I-345	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-OCF ₃)	—	OH
I-346	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SMe)	—	OH
I-347	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SO ₂ Me)	—	OH
I-348	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SCF ₃)	—	OH
I-349	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CO ₂ Me)	—	OH
I-350	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-COMe)	—	OH
I-351	A-1	O	(2-NO ₂)Bn	—	OH
I-352	A-1	O	(2-CN)Bn	—	OH
I-353	A-1	O	(3-SMe)Bn	—	OH
I-354	A-1	O	(3-SO ₂ Me)Bn	—	OH
I-355	A-1	O	(3-SCF ₃)Bn	—	OH
I-356	A-1	O	(3-CO ₂ Me)Bn	—	OH
I-357	A-1	O	(3-COMe)Bn	—	OH
I-358	A-1	O	(3-OMe)Bn	—	OH
I-359	A-1	O		—	OH
I-360	A-1	O		—	OH
I-361	A-1	O		—	OH
I-362	A-1	O		—	OH

Tabela 16

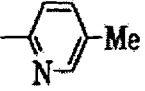
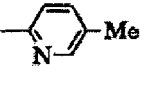
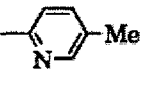
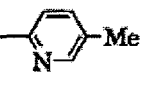
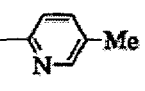
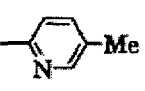
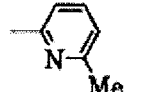
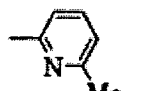
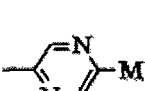
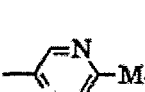
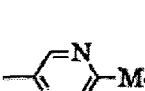
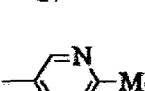
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-363	A-1	O	Et	5-Cl	OH
I-364	A-1	O	n-Bu	5-Cl	OH
I-365	A-1	O		5-F	OH
I-366	A-1	O		5-Cl	OH
I-367	A-1	O		5-Me	OH
I-368	A-1	O		7-Me	OH
I-369	A-1	O		7-CF ₃	OH
I-370	A-1	O		7-OMe	OH
I-371	A-1	O		6-F	OH
I-372	A-1	O		6-CF ₃	OH
I-373	A-1	O		—	OH
I-374	A-1	O		5-F	OH
I-375	A-1	O		5-Cl	OH
I-376	A-1	O		5-Me	OH

Tabela 17

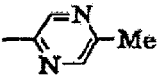
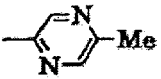
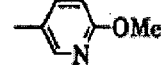
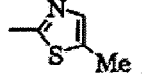
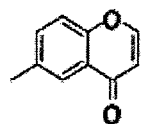
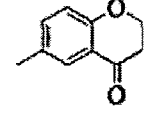
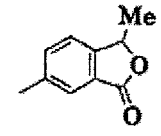
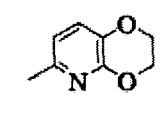
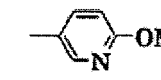
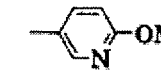
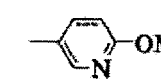
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-377	A-1	O		7-Me	OH
I-378	A-1	O		7-OMe	OH
I-379	A-1	O		5-Cl	OH
I-380	A-1	O		—	OH
I-381	A-1	O		—	OH
I-382	A-1	O		—	OH
I-383	A-1	O		—	OH
I-384	A-1	O		—	OH
I-385	A-1	O		5-Me	OH
I-386	A-1	O		5-Br	OH
I-387	A-1	O		7-Me	OH

Tabela 18

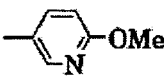
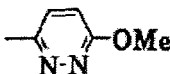
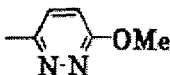
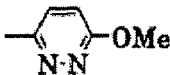
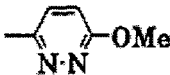
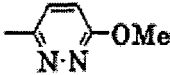
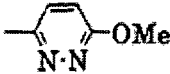
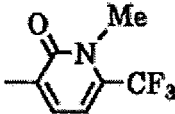
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
I-388	A-1	O		7-OMe	OH
I-389	A-1	O		—	OH
I-390	A-1	O		5-F	OH
I-391	A-1	O		5-Cl	OH
I-392	A-1	O		5-Me	OH
I-393	A-1	O		7-Me	OH
I-394	A-1	O		7-OMe	OH
I-395	A-1	O		—	OH

Tabela 19

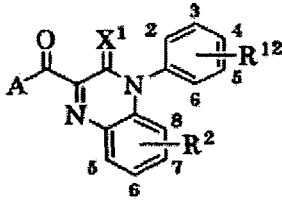
					
Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-1	A-1	O	—	—	OH
II-2	A-2	O	—	—	OH
II-3	A-3	O	—	—	OH
II-4	A-4	O	—	—	OH
II-5	A-5	O	—	—	OH
II-6	A-1	O	2-F	—	OH
II-7	A-1	O	3-F	—	OH
II-8	A-1	O	4-F	—	OH
II-9	A-1	O	2-Cl	—	OH
II-10	A-4	O	2-Cl	—	OH
II-11	A-1	O	3-Cl	—	OH
II-12	A-4	O	3-Cl	—	OH
II-13	A-1	O	4-Cl	—	OH
II-14	A-4	O	4-Cl	—	OH
II-15	A-5	O	4-Cl	—	OH
II-16	A-1	O	2-Br	—	OH
II-17	A-1	O	3-Br	—	OH
II-18	A-1	O	4-Br	—	OH
II-19	A-1	O	2-Me	—	OH
II-20	A-1	O	3-Me	—	OH
II-21	A-1	O	4-Me	—	OH
II-22	A-1	O	2-Et	—	OH
II-23	A-1	O	3-Et	—	OH
II-24	A-1	O	4-Et	—	OH
II-25	A-1	O	2-n-Pr	—	OH
II-26	A-1	O	3-n-Pr	—	OH
II-27	A-1	O	4-n-Pr	—	OH
II-28	A-1	O	2-i-Pr	—	OH
II-29	A-1	O	3-i-Pr	—	OH
II-30	A-1	O	4-i-Pr	—	OH
II-31	A-1	O	2-c-Pr	—	OH
II-32	A-1	O	3-c-Pr	—	OH
II-33	A-1	O	4-c-Pr	—	OH

Tabela 20

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-34	A-1	O	2-CF ₃	—	OH
II-35	A-2	O	2-CF ₃	—	OH
II-36	A-3	O	2-CF ₃	—	OH
II-37	A-4	O	2-CF ₃	—	OH
II-38	A-5	O	2-CF ₃	—	OH
II-39	A-1	O	3-CF ₃	—	OH
II-40	A-2	O	3-CF ₃	—	OH
II-41	A-3	O	3-CF ₃	—	OH
II-42	A-4	O	3-CF ₃	—	OH
II-43	A-5	O	3-CF ₃	—	OH
II-44	A-1	O	4-CF ₃	—	OH
II-45	A-2	O	4-CF ₃	—	OH
II-46	A-3	O	4-CF ₃	—	OH
II-47	A-4	O	4-CF ₃	—	OH
II-48	A-5	O	4-CF ₃	—	OH
II-49	A-1	O	2-OH	—	OH
II-50	A-1	O	3-OH	—	OH
II-51	A-1	O	4-OH	—	OH
II-52	A-1	O	2-OMe	—	OH
II-53	A-2	O	2-OMe	—	OH
II-54	A-3	O	2-OMe	—	OH
II-55	A-4	O	2-OMe	—	OH
II-56	A-5	O	2-OMe	—	OH
II-57	A-1	O	3-OMe	—	OH
II-58	A-2	O	3-OMe	—	OH
II-59	A-3	O	3-OMe	—	OH
II-60	A-4	O	3-OMe	—	OH
II-61	A-5	O	3-OMe	—	OH
II-62	A-1	O	4-OMe	—	OH
II-63	A-2	O	4-OMe	—	OH
II-64	A-3	O	4-OMe	—	OH
II-65	A-4	O	4-OMe	—	OH
II-66	A-5	O	4-OMe	—	OH
II-67	A-1	O	2-OEt	—	OH
II-68	A-1	O	3-OEt	—	OH
II-69	A-1	O	4-OEt	—	OH
II-70	A-1	O	2-O-n-Pr	—	OH
II-71	A-1	O	3-O-n-Pr	—	OH
II-72	A-1	O	4-O-n-Pr	—	OH

Tabela 21

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-73	A-1	O	2-O-i-Pr	—	OH
II-74	A-1	O	3-O-i-Pr	—	OH
II-75	A-1	O	4-O-i-Pr	—	OH
II-76	A-1	O	2-O-c-Pr	—	OH
II-77	A-1	O	3-O-c-Pr	—	OH
II-78	A-1	O	4-O-c-Pr	—	OH
II-79	A-1	O	2-OCH ₂ CH=CH ₂	—	OH
II-80	A-1	O	3-OCH ₂ CH=CH ₂	—	OH
II-81	A-1	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	—	OH
II-82	A-1	O	2-OCH ₂ C≡CH	—	OH
II-83	A-1	O	3-OCH ₂ C≡CH	—	OH
II-84	A-1	O	4-OCH ₂ C≡CH	—	OH
II-85	A-1	O	2-OCHF ₂	—	OH
II-86	A-2	O	2-OCHF ₂	—	OH
II-87	A-3	O	2-OCHF ₂	—	OH
II-88	A-4	O	2-OCHF ₂	—	OH
II-89	A-5	O	2-OCHF ₂	—	OH
II-90	A-1	O	3-OCHF ₂	—	OH
II-91	A-2	O	3-OCHF ₂	—	OH
II-92	A-3	O	3-OCHF ₂	—	OH
II-93	A-4	O	3-OCHF ₂	—	OH
II-94	A-5	O	3-OCHF ₂	—	OH
II-95	A-1	O	4-OCHF ₂	—	OH
II-96	A-2	O	4-OCHF ₂	—	OH
II-97	A-3	O	4-OCHF ₂	—	OH
II-98	A-4	O	4-OCHF ₂	—	OH
II-99	A-5	O	4-OCHF ₂	—	OH
II-100	A-1	O	2-OCF ₃	—	OH
II-101	A-1	O	3-OCF ₃	—	OH
II-102	A-2	O	3-OCF ₃	—	OH
II-103	A-3	O	3-OCF ₃	—	OH
II-104	A-4	O	3-OCF ₃	—	OH
II-105	A-5	O	3-OCF ₃	—	OH
II-106	A-1	O	4-OCF ₃	—	OH
II-107	A-2	O	4-OCF ₃	—	OH
II-108	A-3	O	4-OCF ₃	—	OH
II-109	A-4	O	4-OCF ₃	—	OH
II-110	A-5	O	4-OCF ₃	—	OH
II-111	A-1	O	2-OCH ₂ CH ₂ OMe	—	OH

Tabela 22

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-112	A-1	O	3-OCH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
II-113	A-1	O	4-OCH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
II-114	A-1	O	2-OCH ₂ 	—	OH
II-115	A-1	O	3-OCH ₂ 	—	OH
II-116	A-1	O	4-OCH ₂ 	—	OH
II-117	A-1	O	2-OC(=O)Me	—	OH
II-118	A-1	O	3-OC(=O)Me	—	OH
II-119	A-1	O	3-OC(=O)Me	—	OH
II-120	A-1	O	2-SMe	—	OH
II-121	A-1	O	3-SMe	—	OH
II-122	A-1	O	4-SMe	—	OH
II-123	A-1	O	2-SO ₂ Me	—	OH
II-124	A-1	O	3-SO ₂ Me	—	OH
II-125	A-1	O	4-SO ₂ Me	—	OH
II-126	A-1	O	2-SCF ₃	—	OH
II-127	A-1	O	3-SCF ₃	—	OH
II-128	A-1	O	4-SCF ₃	—	OH
II-129	A-1	O	2-NO ₂	—	OH
II-130	A-1	O	3-NO ₂	—	OH
II-131	A-1	O	4-NO ₂	—	OH
II-132	A-1	O	2-NH ₂	—	OH
II-133	A-1	O	3-NH ₂	—	OH
II-134	A-1	O	4-NH ₂	—	OH
II-135	A-1	O	2-CN	—	OH
II-136	A-1	O	3-CN	—	OH
II-137	A-1	O	4-CN	—	OH
II-138	A-1	O	2-C(=O)Me	—	OH
II-139	A-1	O	3-C(=O)Me	—	OH
II-140	A-1	O	4-C(=O)Me	—	OH
II-141	A-1	O	2-C(=O)OH	—	OH
II-142	A-1	O	3-C(=O)OH	—	OH
II-143	A-1	O	4-C(=O)OH	—	OH
II-144	A-1	O	2-C(=O)OMe	—	OH
II-145	A-1	O	3-C(=O)OMe	—	OH
II-146	A-1	O	4-C(=O)OMe	—	OH

Tabela 23

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-147	A-1	O	2-CH ₂ OMe	—	OH
II-148	A-1	O	3-CH ₂ OMe	—	OH
II-149	A-1	O	4-CH ₂ OMe	—	OH
II-150	A-1	O	2,3-F ₂	—	OH
II-151	A-1	O	2,4-F ₂	—	OH
II-152	A-1	O	2,5-F ₂	—	OH
II-153	A-1	O	2,6-F ₂	—	OH
II-154	A-1	O	3,4-F ₂	—	OH
II-155	A-1	O	3,5-F ₂	—	OH
II-156	A-1	O	2,3-Cl ₂	—	OH
II-157	A-1	O	2,4-Cl ₂	—	OH
II-158	A-1	O	2,5-Cl ₂	—	OH
II-159	A-1	O	2,6-Cl ₂	—	OH
II-160	A-1	O	3,4-Cl ₂	—	OH
II-161	A-1	O	3,5-Cl ₂	—	OH
II-162	A-1	O	2-F, 3-OMe	—	OH
II-163	A-1	O	2-Cl, 3-OMe	—	OH
II-164	A-1	O	2-Me, 3-OMe	—	OH
II-165	A-1	O	2,3-(OMe) ₂	—	OH
II-166	A-1	O	3-OMe, 4-F	—	OH
II-167	A-1	O	3-OMe, 4-Cl	—	OH
II-168	A-1	O	3-OMe, 4-Me	—	OH
II-169	A-1	O	3,4-(OMe) ₂	—	OH
II-170	A-1	O	3-OMe, 5-F	—	OH
II-171	A-1	O	3-OMe, 5-Cl	—	OH
II-172	A-1	O	3-OMe, 5-Me	—	OH
II-173	A-1	O	3,5-(OMe) ₂	—	OH
II-174	A-1	O	2-F, 4-OMe	—	OH
II-175	A-1	O	2-Cl, 4-OMe	—	OH
II-176	A-1	O	2-Me, 4-OMe	—	OH
II-177	A-1	O	2,4-(OMe) ₂	—	OH
II-178	A-1	O	3-F, 4-OMe	—	OH
II-179	A-1	O	3-Cl, 4-OMe	—	OH
II-180	A-1	O	3-Me, 4-OMe	—	OH
II-181	A-1	O	2-F, 5-OMe	—	OH
II-182	A-1	O	2-Cl, 5-OMe	—	OH
II-183	A-1	O	2-Me, 5-OMe	—	OH
II-184	A-1	O	2,5-(OMe) ₂	—	OH
II-185	A-1	O	3,4,5-(OMe) ₃	—	OH

Tabela 24

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-186	A-1	O	4-OMe	5-F	OH
II-187	A-1	O	4-OMe	6-F	OH
II-188	A-1	O	4-OMe	7-F	OH
II-189	A-1	O	4-OMe	8-F	OH
II-190	A-1	O	—	5-Cl	OH
II-191	A-1	O	—	6-Cl	OH
II-192	A-1	O	—	7-Cl	OH
II-193	A-1	O	—	8-Cl	OH
II-194	A-1	O	4-OMe	5-Cl	OH
II-195	A-1	O	4-OMe	6-Cl	OH
II-196	A-1	O	4-OMe	7-Cl	OH
II-197	A-1	O	4-OMe	8-Cl	OH
II-198	A-1	S	—	—	OH
II-199	A-4	O	—	—	S(n-Hex)
II-200	A-4	O	—	—	SO(n-Hex)
II-201	A-4	O	—	—	SO ₂ (n-Hex)
II-202	A-4	O	—	—	SPh
II-203	A-4	O	—	—	SOPh
II-204	A-4	O	—	—	SO ₂ Ph
II-205	A-1	O	4-OCH ₂ CN	—	OH
II-206	A-1	O	3-OCH ₂ -c-Pr	—	OH
II-207	A-1	O	3-OCH ₂ CF ₃	—	OH
II-208	A-1	O	4-OCH ₂ -c-Pr	—	OH
II-209	A-1	O	4-OCH ₂ CF ₃	—	OH
II-210	A-1	O	4-NMe ₂	—	OH
II-211	A-1	O	3,4-Me ₂	—	OH
II-212	A-1	O	2-F, 4-Me	—	OH
II-213	A-1	O	3-F, 4-Me	—	OH
II-214	A-1	O	3-Me, 4-F	—	OH
II-215	A-1	O	2-Cl, 4-Me	—	OH
II-216	A-1	O	3-Cl, 4-Me	—	OH
II-217	A-1	O	3-OEt, 4-OMe	—	OH
II-218	A-1	O	2,3,4-(OMe) ₃	—	OH
II-219	A-1	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	—	OH
II-220	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	—	OH
II-221	A-1	O	3,5-Cl ₂ , 4-OMe	—	OH
II-222	A-1	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	—	OH
II-223	A-1	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	—	OH

Tabela 25

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-224	A-1	O	3,4-(CH ₂ OCH ₂)-	—	OH
II-225	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	7-F	OH
II-226	A-1	O	2,3-(OCH ₂ CH ₂ O)-	—	OH
II-227	A-2	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	—	OH
II-228	A-3	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	—	OH
II-229	A-6	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	—	OH
II-230	A-7	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	—	OH
II-231	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH(Me)O)-	—	OH
II-232	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O)-	—	OH
II-233	A-1	O	—	5-F	OH
II-234	A-1	O	3,4,5-(OMe) ₃	5-F	OH
II-235	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	5-F	OH
II-236	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	5-F	OH
II-237	A-1	O	—	6-F	OH
II-238	A-1	O	3,4,5-(OMe) ₃	6-F	OH
II-239	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-F	OH
II-240	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-F	OH
II-241	A-1	O	—	7-F	OH
II-242	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	7-F	OH
II-243	A-1	O	—	8-F	OH
II-244	A-1	O	—	5-Me	OH
II-245	A-1	O	4-OMe	5-Me	OH
II-246	A-1	O	4-OMe	6-Me	OH
II-247	A-1	O	4-OMe	7-Me	OH
II-248	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-Me	OH
II-249	A-1	O	—	6-CF ₃	OH
II-250	A-1	O	—	6-OMe	OH
II-251	A-1	O	4-OMe	6-OMe	OH
II-252	A-1	O	—	7-OMe	OH
II-253	A-1	O	4-OMe	7-OMe	OH
II-254	A-1	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe	OH
II-255	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe	OH
II-256	A-1	O	—	8-OMe	OH
II-257	A-1	O	4-OMe	8-OMe	OH
II-258	A-1	O	4-OMe	5,6-F ₂	OH
II-259	A-1	O	4-OMe	5,7-F ₂	OH
II-260	A-1	O	—	6,7-F ₂	OH
II-261	A-1	O	—	6,8-F ₂	OH

Tabela 26

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-262	A-1	O	4-OMe	5,7-Cl ₂	OH
II-263	A-1	O	4-OMe	6-F, 7-OMe	OH
II-264	A-1	O	—	7-c-Pr	OH
II-265	A-1	O	—	7-OCH ₂ CH=CH ₂	OH
II-266	A-1	O	—	7-OCH ₂ C≡CH	OH
II-267	A-1	O	—	7-NHMe	OH
II-268	A-1	O	—	7-C(=O)H	OH
II-269	A-1	O	—	6-C(=O)Me	OH
II-270	A-1	O	—	7-C(=O)OH	OH
II-271	A-1	O	—	7-C(=O)OMe	OH
II-272	A-1	O	—	7-C(=O)OEt	OH
II-273	A-1	O	—	7-C(=O)NHNe	OH
II-274	A-1	O	—	7-C(=O)NMe ₂	OH
II-275	A-1	O	—	6,7-(OCH ₂ CH ₂ O)-	OH
II-276	A-1	O	—	6,7-(OCH ₂ O)-	OH
II-277	A-1	O	4-OMe	6,7-(OCH ₂ CH ₂ O)-	OH
II-278	A-1	O	4-OMe	6,7-(OCH ₂ O)-	OH
II-279	A-1	O	2-CONHMe	—	OH
II-280	A-1	O	2-CONMe ₂	—	OH
II-281	A-1	O	2-NHCOMe	—	OH
II-282	A-1	O	4-CH ₂ -c-Pr	—	OH
II-283	A-1	O	4-CH=CH ₂	—	OH
II-284	A-1	O	4-C≡CMe	—	OH
II-285	A-1	O	3-CH=CF ₂	—	OH
II-286	A-1	O	3- 	—	OH
II-287	A-1	O	4- 	—	OH
II-288	A-1	O	4-CH ₂ OH	—	OH
II-289	A-1	O	4-CH ₂ SMe	—	OH
II-290	A-1	O	4-CH ₂ SOMe	—	OH
II-291	A-1	O	4-CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
II-292	A-1	O	4-CH ₂ SCHF ₂	—	OH
II-293	A-1	O	4-CH ₂ SOCHF ₂	—	OH
II-294	A-1	O	4-CH ₂ SO ₂ CHF ₂	—	OH
II-295	A-1	O	4-CH ₂ CN	—	OH

Tabela 27

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
II-296	A-1	O	4-NHMe	—	OH
II-297	A-1	O	4-OCH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
II-298	A-1	O	4-C(Me)=NOMe	—	OH
II-299	A-1	O	2-CONH ₂	—	OH
II-300	A-1	O	4- 	—	OH
II-301	A-1	O	3-F, 4-OMe	5-Cl	OH
II-302	A-1	O	4-OMe	5,6,8-F ₃ , 7-OMe	OH
II-303	A-1	O	—	7-CF ₃	OH
II-304	A-1	O	4-F	7-OMe	OH
II-305	A-1	O	4-OCHF ₂	7-OMe	OH
II-306	A-1	O	4-Me	7-OMe	OH
II-307	A-1	O	4-OMe	5-Br	OH
II-308	A-1	O	4-OMe	5-CN	OH
II-309	A-1	O	4-OMe	5-CF ₃	OH
II-310	A-1	O	2,3,5,6-F ₄ , 4-OMe	—	OH
II-311	A-1	O	4-Me	5-Cl	OH
II-312	A-1	O	3-F, 4-Me	5-Cl	OH
II-313	A-1	O	2-F, 4-OMe	5-Cl	OH
II-314	A-1	O	3-F	6-F	OH
II-315	A-1	O	3-Me	6-F	OH
II-316	A-1	O	3-F, 4-OMe	5-Me	OH
II-317	A-1	O	4-F	5-F	OH
II-318	A-1	O	4-F	5-Cl	OH
II-319	A-1	O	4-F	5-Me	OH
II-320	A-1	O	4-OCHF ₂	5-F	OH
II-321	A-1	O	4-OCHF ₂	5-Cl	OH
II-322	A-1	O	4-OCHF ₂	5-Me	OH
II-323	A-1	O	3-F, 4-OEt	—	OH

Tabela 28

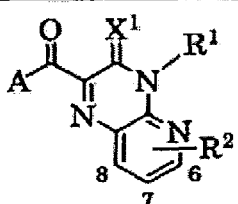
					
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-1	A-1	O	H	—	OH
III-2	A-1	O	Me	—	OH
III-3	A-2	O	Me	—	OH
III-4	A-3	O	Me	—	OH
III-5	A-4	O	Me	—	OH
III-6	A-5	O	Me	—	OH
III-7	A-1	O	Et	—	OH
III-8	A-2	O	Et	—	OH
III-9	A-3	O	Et	—	OH
III-10	A-4	O	Et	—	OH
III-11	A-5	O	Et	—	OH
III-12	A-1	O	n-Pr	—	OH
III-13	A-1	O	i-Pr	—	OH
III-14	A-1	O	c-Pr	—	OH
III-15	A-1	O	n-Bu	—	OH
III-16	A-1	O	s-Bu	—	OH
III-17	A-1	O	i-Bu	—	OH
III-18	A-1	O	t-Bu	—	OH
III-19	A-1	O	c-Bu	—	OH
III-20	A-1	O	n-Pen	—	OH
III-21	A-1	O	c-Pen	—	OH
III-22	A-1	O	n-Hex	—	OH
III-23	A-1	O	c-Hex	—	OH
III-24	A-1	O	n-C ₇ H ₁₅	—	OH
III-25	A-1	O	n-C ₈ H ₁₇	—	OH
III-26	A-1	O	n-C ₉ H ₁₉	—	OH
III-27	A-1	O	n-C ₁₀ H ₂₁	—	OH
III-28	A-1	O	n-C ₁₁ H ₂₃	—	OH
III-29	A-1	O	n-C ₁₂ H ₂₅	—	OH
III-30	A-1	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
III-31	A-2	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
III-32	A-3	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
III-33	A-4	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
III-34	A-5	O	CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
III-35	A-1	O	CH ₂ C≡CH	—	OH

Tabela 29

Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-36	A-2	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
III-37	A-3	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
III-38	A-4	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
III-39	A-5	O	CH ₂ C≡CH	—	OH
III-40	A-1	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
III-41	A-2	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
III-42	A-3	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
III-43	A-4	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
III-44	A-5	O	CH ₂ CF ₃	—	OH
III-45	A-1	O	CH ₂ CH ₂ F	—	OH
III-46	A-1	O	CH ₂ CH ₂ Cl	—	OH
III-47	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CF ₃	—	OH
III-48	A-1	O	CH ₂ CH=CCl ₂	—	OH
III-49	A-1	O	CH ₂ OMe	—	OH
III-50	A-1	O	CH ₂ OEt	—	OH
III-51	A-2	O	CH ₂ OEt	—	OH
III-52	A-3	O	CH ₂ OEt	—	OH
III-53	A-4	O	CH ₂ OEt	—	OH
III-54	A-5	O	CH ₂ OEt	—	OH
III-55	A-1	O	CH(Me)OMe	—	OH
III-56	A-1	O	CH(Me)OEt	—	OH
III-57	A-1	O	CH ₂ OPh	—	OH
III-58	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
III-59	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
III-60	A-2	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
III-61	A-3	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
III-62	A-4	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
III-63	A-5	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—	OH
III-64	A-1	O	CH(Me)OCH ₂ CF ₃	—	OH
III-65	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ - 	—	OH
III-66	A-1	O	CH(Me)OCH ₂ - 	—	OH
III-67	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
III-68	A-1	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	—	OH
III-69	A-1	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	—	OH
III-70	A-1	O	CH ₂ SMe	—	OH
III-71	A-4	O	CH ₂ SMe	—	OH
III-72	A-1	O	CH ₂ SEt	—	OH

Tabela 30

Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-73	A-1	O	CH ₂ S-n-Pr	—	OH
III-74	A-1	O	CH(Me)SMe	—	OH
III-75	A-1	O	CH(Me)SEt	—	OH
III-76	A-1	O	CH(Me)S-n-Pr	—	OH
III-77	A-1	O	CH ₂ SOMe	—	OH
III-78	A-1	O	CH ₂ SOEt	—	OH
III-79	A-1	O	CH ₂ SO-n-Pr	—	OH
III-80	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
III-81	A-4	O	CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
III-82	A-1	O	CH ₂ SO ₂ Et	—	OH
III-83	A-1	O	CH ₂ SO ₂ -n-Pr	—	OH
III-84	A-1	O	CH(Me)SO ₂ Me	—	OH
III-85	A-1	O	CH(Me)SO ₂ Et	—	OH
III-86	A-1	O	CH(Me)SO ₂ -n-Pr	—	OH
III-87	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OH	—	OH
III-88	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
III-89	A-1	O	CH ₂ CH ₂ OEt	—	OH
III-90	A-1	O	CH(Me)CH ₂ OMe	—	OH
III-91	A-1	O	CH ₂ CH ₂ SMe	—	OH
III-92	A-1	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—	OH
III-93	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
III-94	A-1	O	CH ₂ C(=O)Me	—	OH
III-95	A-1	O	CH ₂ C(=O)OMe	—	OH
III-96	A-1	O	CH ₂ C(=O)OEt	—	OH
III-97	A-1	O	CH ₂ C(=O)O-n-Pr	—	OH
III-98	A-1	O	CH ₂ C(=O)O-i-Pr	—	OH
III-99	A-1	O	CH ₂ C(=O)Ot-Bu	—	OH
III-100	A-1	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	—	OH
III-101	A-1	O	CH ₂ C(=O)-N 	—	OH
III-102	A-1	O	CH ₂ CN	—	OH
III-103	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CN	—	OH
III-104	A-1	O	CH(Me)CH ₂ CN	—	OH
III-105	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	—	OH
III-106	A-1	O	CH ₂ CH ₂ NO ₂	—	OH
III-107	A-1	O	Bn	—	OH
III-108	A-1	O	(2-F)Bn	—	OH
III-109	A-1	O	(3-F)Bn	—	OH
III-110	A-1	O	(4-F)Bn	—	OH
III-111	A-1	O	(2-Cl)Bn	—	OH

Tabela 31

Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-112	A-1	O	(3-Cl)Bn	—	OH
III-113	A-1	O	(4-Cl)Bn	—	OH
III-114	A-1	O	(2-Me)Bn	—	OH
III-115	A-1	O	(3-Me)Bn	—	OH
III-116	A-1	O	(4-Me)Bn	—	OH
III-117	A-1	O	(2-CF ₃)Bn	—	OH
III-118	A-1	O	(3-CF ₃)Bn	—	OH
III-119	A-1	O	(4-CF ₃)Bn	—	OH
III-120	A-1	O	(2-OMe)Bn	—	OH
III-121	A-2	O	(2-OMe)Bn	—	OH
III-122	A-3	O	(2-OMe)Bn	—	OH
III-123	A-4	O	(2-OMe)Bn	—	OH
III-124	A-5	O	(2-OMe)Bn	—	OH
III-125	A-1	O	(3-OMe)Bn	—	OH
III-126	A-1	O	(4-OMe)Bn	—	OH
III-127	A-1	O	(2,4-(OMe) ₂)Bn	—	OH
III-128	A-1	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	—	OH
III-129	A-1	O	(3,5-(OMe) ₂)Bn	—	OH
III-130	A-1	O	CH(Me)Ph	—	OH
III-131	A-1	O		—	OH
III-132	A-2	O		—	OH
III-133	A-3	O		—	OH
III-134	A-4	O		—	OH
III-135	A-5	O		—	OH
III-136	A-1	O		—	OH
III-137	A-1	O		—	OH
III-138	A-1	O		—	OH
III-139	A-1	O		—	OH
III-140	A-2	O		—	OH

Tabela 32

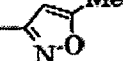
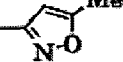
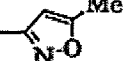
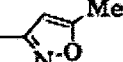
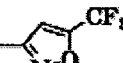
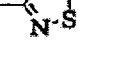
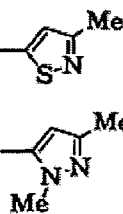
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-141	A-3	O		—	OH
III-142	A-4	O		—	OH
III-143	A-5	O		—	OH
III-144	A-1	O		—	OH
III-145	A-1	O		—	OH
III-146	A-2	O		—	OH
III-147	A-3	O		—	OH
III-148	A-4	O		—	OH
III-149	A-5	O		—	OH
III-150	A-1	O		—	OH
III-151	A-1	O		—	OH
III-152	A-1	O		—	OH
III-153	A-1	O		—	OH
III-154	A-1	O		—	OH
III-155	A-1	O		—	OH
III-156	A-1	O		—	OH
III-157	A-1	O		—	OH

Tabela 33

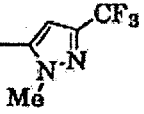
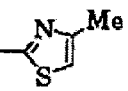
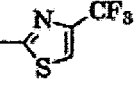
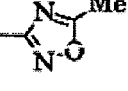
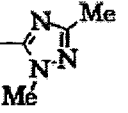
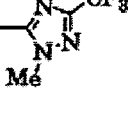
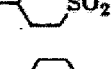
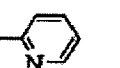
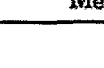
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-158	A-1	O		—	OH
III-159	A-1	O		—	OH
III-160	A-1	O		—	OH
III-161	A-1	O		—	OH
III-162	A-1	O		—	OH
III-163	A-1	O		—	OH
III-164	A-1	O		—	OH
III-165	A-1	O		—	OH
III-166	A-1	O		—	OH
III-167	A-1	O		—	OH
III-168	A-1	O		—	OH
III-169	A-1	O		—	OH
III-170	A-1	O		—	OH
III-171	A-1	O		—	OH
III-172	A-1	O		—	OH
III-173	A-1	O		—	OH

Tabela 34

Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-174	A-1	O		—	OH
III-175	A-1	O		—	OH
III-176	A-1	O		—	OH
III-177	A-1	O		—	OH
III-178	A-1	O		—	OH
III-179	A-1	O		—	OH
III-180	A-1	O		—	OH
III-181	A-1	O		—	OH
III-182	A-1	O		—	OH
III-183	A-1	O		—	OH
III-184	A-1	O		—	OH
III-185	A-1	O		—	OH
III-186	A-1	O		—	OH
III-187	A-1	O		—	OH
III-188	A-1	O		—	OH
III-189	A-1	O		—	OH
III-190	A-2	O		—	OH

Tabela 35

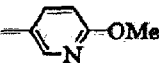
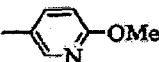
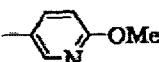
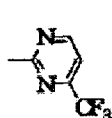
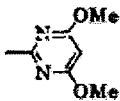
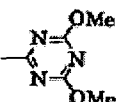
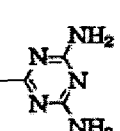
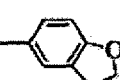
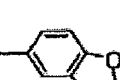
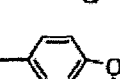
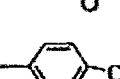
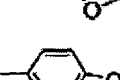
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-191	A-3	O		—	OH
III-192	A-4	O		—	OH
III-193	A-5	O		—	OH
III-194	A-1	O		—	OH
III-195	A-1	O		—	OH
III-196	A-1	O		—	OH
III-197	A-1	O		—	OH
III-198	A-1	O		—	OH
III-199	A-1	O		—	OH
III-200	A-1	O		—	OH
III-201	A-1	O		—	OH
III-202	A-1	O		—	OH
III-203	A-2	O		—	OH
III-204	A-3	O		—	OH
III-205	A-4	O		—	OH

Tabela 36

Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-206	A-5	O		—	OH
III-207	A-1	O		—	OH
III-208	A-1	O		—	OH
III-209	A-1	O		—	OH
III-210	A-1	O		—	OH
III-211	A-1	O		—	OH
III-212	A-1	O		—	OH
III-213	A-1	O		—	OH
III-214	A-1	O	NH ₂	—	OH
III-215	A-1	O	NHMe	—	OH
III-216	A-1	O	NMe ₂	—	OH
III-217	A-1	O	OMe	—	OH
III-218	A-1	O	OEt	—	OH
III-219	A-1	O	Me	6-F	OH
III-220	A-1	O	Me	6-Cl	OH
III-221	A-1	O	Me	6-OMe	OH
III-222	A-1	S	Me	—	OH
III-223	A-4	O	Me	—	S(n-Hex)
III-224	A-4	O	Me	—	SO(n-Hex)
III-225	A-4	O	Me	—	SO ₂ (n-Hex)
III-226	A-4	O	Me	—	SPh
III-227	A-4	O	Me	—	SOPh
III-228	A-4	O	Me	—	SO ₂ Ph
III-229	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	—	OH
III-230	A-1	O	CH ₂ CH ₂ CH=C(Me) ₂	—	OH
III-231	A-1	O	CH ₂ CH ₂ C≡CH	—	OH
III-232	A-1	O	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	—	OH
III-233	A-1	O	CH(Me)C(=O)Ot-Bu	—	OH

Tabela 37

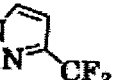
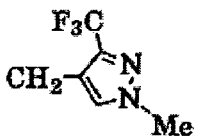
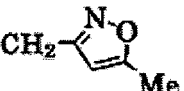
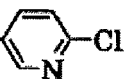
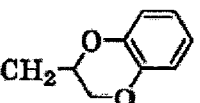
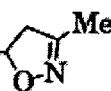
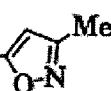
Composto No.	A	X ¹	R ¹	R ²	R ³
III-234	A-1	O	(2-OCHF ₂)Bn	—	OH
III-235	A-1	O	CH ₂ CH ₂ Ph	—	OH
III-236	A-1	O	CH ₂ - 	—	OH
III-237	A-1	O	CH ₂ -N 	—	OH
III-238	A-1	O	 CH ₂	—	OH
III-239	A-1	O	CH ₂ - 	—	OH
III-240	A-1	O	CH ₂ - 	—	OH
III-241	A-1	O	CH ₂ - 	—	OH
III-242	A-1	O	CH ₂ CH ₂ - 	—	OH
III-243	A-1	O	CH ₂ CH ₂ - 	—	OH
III-244	A-1	O	Bn	8-Me	OH
III-245	A-1	O	Bn	7-Me	OH
III-246	A-1	O	Bn	6-Me	OH
III-247	A-1	O	Bn	6-OMe	OH

Tabela 38

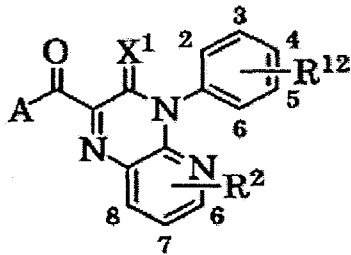
					
Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-1	A-1	O	—	—	OH
IV-2	A-2	O	—	—	OH
IV-3	A-3	O	—	—	OH
IV-4	A-4	O	—	—	OH
IV-5	A-5	O	—	—	OH
IV-6	A-1	O	2-F	—	OH
IV-7	A-1	O	3-F	—	OH
IV-8	A-1	O	4-F	—	OH
IV-9	A-1	O	2-Cl	—	OH
IV-10	A-4	O	2-Cl	—	OH
IV-11	A-1	O	3-Cl	—	OH
IV-12	A-4	O	3-Cl	—	OH
IV-13	A-1	O	4-Cl	—	OH
IV-14	A-4	O	4-Cl	—	OH
IV-15	A-5	O	4-Cl	—	OH
IV-16	A-1	O	2-Br	—	OH
IV-17	A-1	O	3-Br	—	OH
IV-18	A-1	O	4-Br	—	OH
IV-19	A-1	O	2-Me	—	OH
IV-20	A-1	O	3-Me	—	OH
IV-21	A-1	O	4-Me	—	OH
IV-22	A-1	O	2-Et	—	OH
IV-23	A-1	O	3-Et	—	OH
IV-24	A-1	O	4-Et	—	OH
IV-25	A-1	O	2-n-Pr	—	OH
IV-26	A-1	O	3-n-Pr	—	OH
IV-27	A-1	O	4-n-Pr	—	OH
IV-28	A-1	O	2-i-Pr	—	OH
IV-29	A-1	O	3-i-Pr	—	OH
IV-30	A-1	O	4-i-Pr	—	OH
IV-31	A-1	O	2-c-Pr	—	OH
IV-32	A-1	O	3-c-Pr	—	OH
IV-33	A-1	O	4-c-Pr	—	OH
IV-34	A-1	O	2-CF ₃	—	OH

Tabela 39

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-35	A-2	O	2-CF ₃	—	OH
IV-36	A-3	O	2-CF ₃	—	OH
IV-37	A-4	O	2-CF ₃	—	OH
IV-38	A-5	O	2-CF ₃	—	OH
IV-39	A-1	O	3-CF ₃	—	OH
IV-40	A-2	O	3-CF ₃	—	OH
IV-41	A-3	O	3-CF ₃	—	OH
IV-42	A-4	O	3-CF ₃	—	OH
IV-43	A-5	O	3-CF ₃	—	OH
IV-44	A-1	O	4-CF ₃	—	OH
IV-45	A-2	O	4-CF ₃	—	OH
IV-46	A-3	O	4-CF ₃	—	OH
IV-47	A-4	O	4-CF ₃	—	OH
IV-48	A-5	O	4-CF ₃	—	OH
IV-49	A-1	O	2-OH	—	OH
IV-50	A-1	O	3-OH	—	OH
IV-51	A-1	O	4-OH	—	OH
IV-52	A-1	O	2-OMe	—	OH
IV-53	A-2	O	2-OMe	—	OH
IV-54	A-3	O	2-OMe	—	OH
IV-55	A-4	O	2-OMe	—	OH
IV-56	A-5	O	2-OMe	—	OH
IV-57	A-1	O	3-OMe	—	OH
IV-58	A-2	O	3-OMe	—	OH
IV-59	A-3	O	3-OMe	—	OH
IV-60	A-4	O	3-OMe	—	OH
IV-61	A-5	O	3-OMe	—	OH
IV-62	A-1	O	4-OMe	—	OH
IV-63	A-2	O	4-OMe	—	OH
IV-64	A-3	O	4-OMe	—	OH
IV-65	A-4	O	4-OMe	—	OH
IV-66	A-5	O	4-OMe	—	OH
IV-67	A-1	O	2-OEt	—	OH
IV-68	A-1	O	3-OEt	—	OH
IV-69	A-1	O	4-OEt	—	OH
IV-70	A-1	O	2-O-n-Pr	—	OH
IV-71	A-1	O	3-O-n-Pr	—	OH
IV-72	A-1	O	4-O-n-Pr	—	OH
IV-73	A-1	O	2-O-i-Pr	—	OH
IV-74	A-1	O	3-O-i-Pr	—	OH
IV-75	A-1	O	4-O-i-Pr	—	OH

Tabela 40

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-76	A-1	O	2-O-c-Pr	—	OH
IV-77	A-1	O	3-O-c-Pr	—	OH
IV-78	A-1	O	4-O-c-Pr	—	OH
IV-79	A-1	O	2-OCH ₂ CH=CH ₂	—	OH
IV-80	A-1	O	3-OCH ₂ CH=CH ₂	—	OH
IV-81	A-1	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	—	OH
IV-82	A-1	O	2-OCH ₂ C≡CH	—	OH
IV-83	A-1	O	3-OCH ₂ C≡CH	—	OH
IV-84	A-1	O	4-OCH ₂ C≡CH	—	OH
IV-85	A-1	O	2-OCHF ₂	—	OH
IV-86	A-2	O	2-OCHF ₂	—	OH
IV-87	A-3	O	2-OCHF ₂	—	OH
IV-88	A-4	O	2-OCHF ₂	—	OH
IV-89	A-5	O	2-OCHF ₂	—	OH
IV-90	A-1	O	3-OCHF ₂	—	OH
IV-91	A-2	O	3-OCHF ₂	—	OH
IV-92	A-3	O	3-OCHF ₂	—	OH
IV-93	A-4	O	3-OCHF ₂	—	OH
IV-94	A-5	O	3-OCHF ₂	—	OH
IV-95	A-1	O	4-OCHF ₂	—	OH
IV-96	A-2	O	4-OCHF ₂	—	OH
IV-97	A-3	O	4-OCHF ₂	—	OH
IV-98	A-4	O	4-OCHF ₂	—	OH
IV-99	A-5	O	4-OCHF ₂	—	OH
IV-100	A-1	O	2-OCF ₃	—	OH
IV-101	A-1	O	3-OCF ₃	—	OH
IV-102	A-2	O	3-OCF ₃	—	OH
IV-103	A-3	O	3-OCF ₃	—	OH
IV-104	A-4	O	3-OCF ₃	—	OH
IV-105	A-5	O	3-OCF ₃	—	OH
IV-106	A-1	O	4-OCF ₃	—	OH
IV-107	A-2	O	4-OCF ₃	—	OH
IV-108	A-3	O	4-OCF ₃	—	OH
IV-109	A-4	O	4-OCF ₃	—	OH
IV-110	A-5	O	4-OCF ₃	—	OH
IV-111	A-1	O	2-OCH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
IV-112	A-1	O	3-OCH ₂ CH ₂ OMe	—	OH
IV-113	A-1	O	4-OCH ₂ CH ₂ OMe	—	OH

Tabela 41

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-114	A-1	O	2-OCH ₂ 	—	OH
IV-115	A-1	O	3-OCH ₂ 	—	OH
IV-116	A-1	O	4-OCH ₂ 	—	OH
IV-117	A-1	O	2-OC(=O)Me	—	OH
IV-118	A-1	O	3-OC(=O)Me	—	OH
IV-119	A-1	O	3-OC(=O)Me	—	OH
IV-120	A-1	O	2-SMe	—	OH
IV-121	A-1	O	3-SMe	—	OH
IV-122	A-1	O	4-SMe	—	OH
IV-123	A-1	O	2-SO ₂ Me	—	OH
IV-124	A-1	O	3-SO ₂ Me	—	OH
IV-125	A-1	O	4-SO ₂ Me	—	OH
IV-126	A-1	O	2-SCF ₃	—	OH
IV-127	A-1	O	3-SCF ₃	—	OH
IV-128	A-1	O	4-SCF ₃	—	OH
IV-129	A-1	O	2-NO ₂	—	OH
IV-130	A-1	O	3-NO ₂	—	OH
IV-131	A-1	O	4-NO ₂	—	OH
IV-132	A-1	O	2-NH ₂	—	OH
IV-133	A-1	O	3-NH ₂	—	OH
IV-134	A-1	O	4-NH ₂	—	OH
IV-135	A-1	O	2-CN	—	OH
IV-136	A-1	O	3-CN	—	OH
IV-137	A-1	O	4-CN	—	OH
IV-138	A-1	O	2-C(=O)Me	—	OH
IV-139	A-1	O	3-C(=O)Me	—	OH
IV-140	A-1	O	4-C(=O)Me	—	OH
IV-141	A-1	O	2-C(=O)OH	—	OH
IV-142	A-1	O	3-C(=O)OH	—	OH
IV-143	A-1	O	4-C(=O)OH	—	OH
IV-144	A-1	O	2-C(=O)OMe	—	OH
IV-145	A-1	O	3-C(=O)OMe	—	OH
IV-146	A-1	O	4-C(=O)OMe	—	OH
IV-147	A-1	O	2-CH ₂ OMe	—	OH
IV-148	A-1	O	3-CH ₂ OMe	—	OH

Tabela 42

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-149	A-1	O	4-CH ₂ OMe	—	OH
IV-150	A-1	O	2,3-F ₂	—	OH
IV-151	A-1	O	2,4-F ₂	—	OH
IV-152	A-1	O	2,5-F ₂	—	OH
IV-153	A-1	O	2,6-F ₂	—	OH
IV-154	A-1	O	3,4-F ₂	—	OH
IV-155	A-1	O	3,5-F ₂	—	OH
IV-156	A-1	O	2,3-Cl ₂	—	OH
IV-157	A-1	O	2,4-Cl ₂	—	OH
IV-158	A-1	O	2,5-Cl ₂	—	OH
IV-159	A-1	O	2,6-Cl ₂	—	OH
IV-160	A-1	O	3,4-Cl ₂	—	OH
IV-161	A-1	O	3,5-Cl ₂	—	OH
IV-162	A-1	O	2-F, 3-OMe	—	OH
IV-163	A-1	O	2-Cl, 3-OMe	—	OH
IV-164	A-1	O	2-Me, 3-OMe	—	OH
IV-165	A-1	O	2,3-(OMe) ₂	—	OH
IV-166	A-1	O	3-OMe, 4-F	—	OH
IV-167	A-1	O	3-OMe, 4-Cl	—	OH
IV-168	A-1	O	3-OMe, 4-Me	—	OH
IV-169	A-1	O	3,4-(OMe) ₂	—	OH
IV-170	A-1	O	3-OMe, 5-F	—	OH
IV-171	A-1	O	3-OMe, 5-Cl	—	OH
IV-172	A-1	O	3-OMe, 5-Me	—	OH
IV-173	A-1	O	3,5-(OMe) ₂	—	OH
IV-174	A-1	O	2-F, 4-OMe	—	OH
IV-175	A-1	O	2-Cl, 4-OMe	—	OH
IV-176	A-1	O	2-Me, 4-OMe	—	OH
IV-177	A-1	O	2,4-(OMe) ₂	—	OH
IV-178	A-1	O	3-F, 4-OMe	—	OH
IV-179	A-1	O	3-Cl, 4-OMe	—	OH
IV-180	A-1	O	3-Me, 4-OMe	—	OH
IV-181	A-1	O	2-F, 5-OMe	—	OH
IV-182	A-1	O	2-Cl, 5-OMe	—	OH
IV-183	A-1	O	2-Me, 5-OMe	—	OH
IV-184	A-1	O	2,5-(OMe) ₂	—	OH
IV-185	A-1	O	3,4,5-(OMe) ₃	—	OH
IV-186	A-1	O	—	6-F	OH
IV-187	A-1	O	4-OMe	6-F	OH

Tabela 43

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ⁸
IV-188	A-1	O	—	6-Cl	OH
IV-189	A-1	O	4-OMe	6-Cl	OH
IV-190	A-1	O	—	6-OMe	OH
IV-191	A-1	O	4-OMe	6-OMe	OH
IV-192	A-1	S	—	—	OH
IV-193	A-1	S	4-OMe	—	OH
IV-194	A-4	O	—	—	S(n-Hex)
IV-195	A-4	O	—	—	SO(n-Hex)
IV-196	A-4	O	—	—	SO ₂ (n-Hex)
IV-197	A-4	O	—	—	SPh
IV-198	A-4	O	—	—	SOPh
IV-199	A-4	O	—	—	SO ₂ Ph
IV-200	A-1	O	2-F,5-CF ₃	—	OH
IV-201	A-1	O	3-CF ₃ ,4-F	—	OH
IV-202	A-1	O	2-F,3-CF ₃	—	OH
IV-203	A-1	O	3-F,5-CF ₃	—	OH
IV-204	A-1	O	2,3-(Me) ₂	—	OH
IV-205	A-1	O	2,4-(Me) ₂	—	OH
IV-206	A-1	O	2,5-(Me) ₂	—	OH
IV-207	A-1	O	2,6-(Me) ₂	—	OH
IV-208	A-1	O	3,4-(Me) ₂	—	OH
IV-209	A-1	O	3,5-(Me) ₂	—	OH
IV-210	A-1	O	3,5-(CF ₃) ₂	—	OH
IV-211	A-1	O	2,6-(OMe) ₂	—	OH
IV-212	A-1	O	2-F, 3-Cl	—	OH
IV-213	A-1	O	2-F, 4-Cl	—	OH
IV-214	A-1	O	2-F, 5-Cl	—	OH
IV-215	A-1	O	3-F, 4-Cl	—	OH
IV-216	A-1	O	4-F, 2-Cl	—	OH
IV-217	A-1	O	4-F, 3-Cl	—	OH
IV-218	A-1	O	2-F, 3-Me	—	OH
IV-219	A-1	O	2-F, 4-Me	—	OH
IV-220	A-1	O	2-F, 5-Me	—	OH
IV-221	A-1	O	3-F, 2-Me	—	OH
IV-222	A-1	O	3-F, 4-Me	—	OH
IV-223	A-4	O	3-F, 4-Me	—	OH
IV-224	A-1	O	3-F, 5-Me	—	OH
IV-225	A-1	O	4-F, 2-Me	—	OH
IV-226	A-1	O	4-F, 3-Me	—	OH

Tabela 44

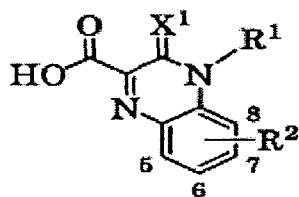
Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-227	A-1	O	5-F, 2-Me	—	OH
IV-228	A-1	O	2-F, 4-CF ₃	—	OH
IV-229	A-1	O	3-F, 4-CF ₃	—	OH
IV-230	A-1	O	4-F, 2-CF ₃	—	OH
IV-231	A-1	O	3-F, 2-OMe	—	OH
IV-232	A-1	O	4-F, 2-OMe	—	OH
IV-233	A-1	O	5-F, 2-OMe	—	OH
IV-234	A-1	O	2-F, 4-OCHF ₂	—	OH
IV-235	A-1	O	3-F, 4-OCHF ₂	—	OH
IV-236	A-1	O	4-F, 2-OCHF ₂	—	OH
IV-237	A-1	O	4-F, 3-CN	—	OH
IV-238	A-1	O	2-Cl, 4-Me	—	OH
IV-239	A-1	O	3-Cl, 4-Me	—	OH
IV-240	A-1	O	3-Cl, 4-OCHF ₂	—	OH
IV-241	A-1	O	4-Me, 3-CF ₃	—	OH
IV-242	A-1	O	4-Me, 2-OMe	—	OH
IV-243	A-1	O	3-Me, 4-CN	—	OH
IV-244	A-1	O	4-Me, 3-CN	—	OH
IV-245	A-1	O	2,3,4-F ₃	—	OH
IV-246	A-1	O	2,3,5-F ₃	—	OH
IV-247	A-1	O	2,4,5-F ₃	—	OH
IV-248	A-1	O	3,4,5-F ₃	—	OH
IV-249	A-1	O	2,3-F ₂ , 4-Me	—	OH
IV-250	A-1	O	2,6-F ₂ , 4-OMe	—	OH
IV-251	A-1	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	—	OH
IV-252	A-1	O	4-F, 2-Cl, 5-Me	—	OH
IV-253	A-1	O	—	7-Cl	OH
IV-254	A-1	O	—	6-Me	OH
IV-255	A-1	O	—	7-Me	OH
IV-256	A-1	O	—	8-Me	OH
IV-257	A-1	O	3-Me	8-Me	OH
IV-258	A-1	O	3-CF ₃	8-Me	OH
IV-259	A-1	O	4-OMe	8-Me	OH
IV-260	A-1	O	3-F, 4-Me	8-Me	OH
IV-261	A-4	O	3-F, 4-Me	8-Me	OH
IV-262	A-1	O	3-F, 4-OMe	8-Me	OH
IV-263	A-1	O	—	8-OMe	OH
IV-264	A-1	O	3-CF ₃	8-OMe	OH

Tabela 45

Composto No.	A	X ¹	R ¹²	R ²	R ³
IV-265	A-1	O	3-F, 4-Me	8-Cl	OH
IV-266	A-1	O	3-F, 4-Me	6-F	OH
IV-267	A-1	O	3-F, 4-Me	6-Cl	OH
IV-268	A-1	O	3-F, 4-Me	7-Me	OH
IV-269	A-1	O	3-F, 4-Me	6-Me	OH
IV-270	A-1	O	—	8-Cl	OH
IV-271	A-1	O	3-F, 4-Me	6-OMe	OH
IV-272	A-1	O	3-F, 4-Me	6-OMe	OH
IV-273	A-1	O	4-OMe	8-Cl	OH
IV-274	A-1	O	4-OMe	6,8-Me ₂	OH
IV-275	A-1	O	3-F, 4-OMe	6,8-Me ₂	OH
IV-276	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Me	OH
IV-277	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	8-Me	OH
IV-278	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6,8-Me ₂	OH
IV-279	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6,8-Me ₂	OH
IV-280	A-1	O	4-OMe	6-Cl, 8-Me	OH
IV-281	A-1	O	3-F, 4-OMe	6-Cl, 8-Me	OH
IV-282	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-Cl, 8-Me	OH
IV-283	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-Cl, 8-Me	OH
IV-284	A-1	O	—	6-SMe	OH
IV-285	A-1	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-OMe	OH
IV-286	A-1	O	3-F, 4-OEt	—	OH
IV-287	A-1	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Cl	OH

Exemplos específicos preferidos do composto representado pela fórmula [J2] que é um intermediário de produção da presente invenção será mostrado na seguinte tabela 46 a tabela 81. Entretanto, o composto não se destina a ser limitado a estes compostos como no caso do composto da
5 presente invenção. Adicionalmente, números do composto serão referidos nas seguintes descrições, e as notações nas tabelas têm os mesmos significados mencionados anteriormente.

Tabela 46



Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-1	O	H	—
V-2	O	Me	—
V-3	O	Et	—
V-4	O	n-Pr	—
V-5	O	i-Pr	—
V-6	O	c-Pr	—
V-7	O	n-Bu	—
V-8	O	s-Bu	—
V-9	O	i-Bu	—
V-10	O	t-Bu	—
V-11	O	c-Bu	—
V-12	O	n-Pen	—
V-13	O	c-Pen	—
V-14	O	n-Hex	—
V-15	O	c-Hex	—
V-16	O	n-C ₇ H ₁₅	—
V-17	O	n-C ₈ H ₁₇	—
V-18	O	n-C ₉ H ₁₉	—
V-19	O	n-C ₁₀ H ₂₁	—
V-20	O	n-C ₁₁ H ₂₃	—
V-21	O	n-C ₁₂ H ₂₅	—
V-22	O	CH ₂ CH=CH ₂	—
V-23	O	CH ₂ C≡CH	—
V-24	O	CH ₂ CF ₃	—
V-25	O	CH ₂ CH ₂ F	—
V-26	O	CH ₂ CH ₂ Cl	—
V-27	O	CH ₂ CH ₂ CF ₃	—
V-28	O	CH ₂ CH=CCl ₂	—
V-29	O	CH ₂ OMe	—
V-30	O	CH ₂ OEt	—
V-31	O	CH(Me)OMe	—
V-32	O	CH(Me)OEt	—
V-33	O	CH ₂ OPh	—
V-34	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	—

Tabela 47

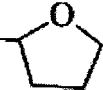
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-35	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—
V-36	O	CH(Me)OCH ₂ CF ₃	—
V-37	O	CH ₂ OCH ₂ 	—
V-38	O	CH(Me)OCH ₂ 	—
V-39	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—
V-40	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	—
V-41	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	—
V-42	O	CH ₂ SMe	—
V-43	O	CH ₂ SEt	—
V-44	O	CH ₂ S-n-Pr	—
V-45	O	CH(Me)SMe	—
V-46	O	CH(Me)SEt	—
V-47	O	CH(Me)S-n-Pr	—
V-48	O	CH ₂ SOMe	—
V-49	O	CH ₂ SOEt	—
V-50	O	CH ₂ SO-n-Pr	—
V-51	O	CH ₂ SO ₂ Me	—
V-52	O	CH ₂ SO ₂ Et	—
V-53	O	CH ₂ SO ₂ -n-Pr	—
V-54	O	CH(Me)SO ₂ Me	—
V-55	O	CH(Me)SO ₂ Et	—
V-56	O	CH(Me)SO ₂ -n-Pr	—
V-57	O	CH ₂ CH ₂ OH	—
V-58	O	CH ₂ CH ₂ OMe	—
V-59	O	CH ₂ CH ₂ OEt	—
V-60	O	CH(Me)CH ₂ OMe	—
V-61	O	CH ₂ CH ₂ SMe	—
V-62	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—
V-63	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	—
V-64	O	CH ₂ C(=O)Me	—
V-65	O	CH ₂ C(=O)OMe	—
V-66	O	CH ₂ C(=O)OEt	—
V-67	O	CH ₂ C(=O)O-n-Pr	—
V-68	O	CH ₂ C(=O)O-i-Pr	—
V-69	O	CH ₂ C(=O)O-t-Bu	—
V-70	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	—

Tabela 48

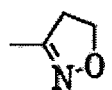
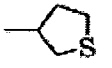
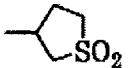
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-71	O	$\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-\text{N}$ 	—
V-72	O	CH_2CN	—
V-73	O	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	—
V-74	O	$\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CN}$	—
V-75	O	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	—
V-76	O	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$	—
V-77	O	Bn	—
V-78	O	(2-F)Bn	—
V-79	O	(3-F)Bn	—
V-80	O	(4-F)Bn	—
V-81	O	(2-Cl)Bn	—
V-82	O	(3-Cl)Bn	—
V-83	O	(4-Cl)Bn	—
V-84	O	(2-Me)Bn	—
V-85	O	(3-Me)Bn	—
V-86	O	(4-Me)Bn	—
V-87	O	(2-CF ₃)Bn	—
V-88	O	(3-CF ₃)Bn	—
V-89	O	(4-CF ₃)Bn	—
V-90	O	(2-OMe)Bn	—
V-91	O	(3-OMe)Bn	—
V-92	O	(4-OMe)Bn	—
V-93	O	(2,4-(OMe) ₂)Bn	—
V-94	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	—
V-95	O	(3,5-(OMe) ₂)Bn	—
V-96	O	$\text{CH}(\text{Me})\text{Ph}$	—
V-97	O		—
V-98	O		—
V-99	O		—
V-100	O		—

Tabela 49

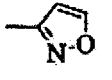
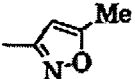
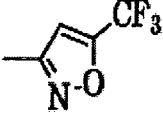
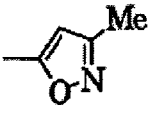
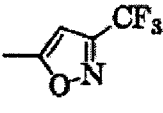
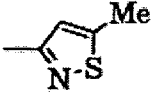
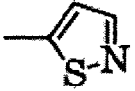
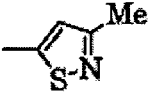
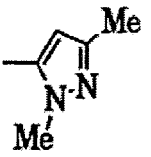
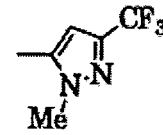
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-101	O		—
V-102	O		—
V-103	O		—
V-104	O		—
V-105	O		—
V-106	O		—
V-107	O		—
V-108	O		—
V-109	O		—
V-110	O		—
V-111	O		—
V-112	O		—

Tabela 50

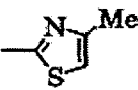
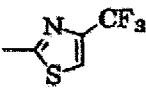
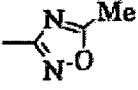
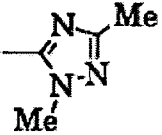
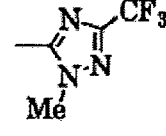
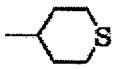
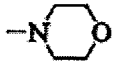
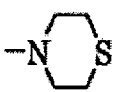
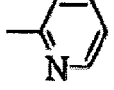
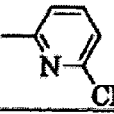
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-113	O		—
V-114	O		—
V-115	O		—
V-116	O		—
V-117	O		—
V-118	O		—
V-119	O		—
V-120	O		—
V-121	O		—
V-122	O		—
V-123	O		—
V-124	O		—
V-125	O		—
V-126	O		—

Tabela 51

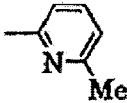
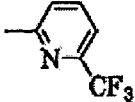
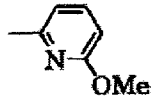
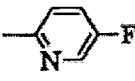
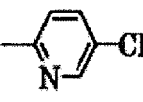
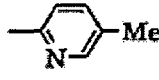
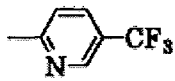
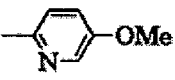
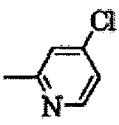
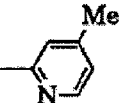
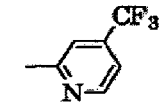
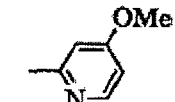
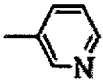
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-127	O		—
V-128	O		—
V-129	O		—
V-130	O		—
V-131	O		—
V-132	O		—
V-133	O		—
V-134	O		—
V-135	O		—
V-136	O		—
V-137	O		—
V-138	O		—
V-139	O		—

Tabela 52

Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-140	O		—
V-141	O		—
V-142	O		—
V-143	O		—
V-144	O		—
V-145	O		—
V-146	O		—
V-147	O		—
V-148	O		—
V-149	O		—
V-150	O		—
V-151	O		—

Tabela 53

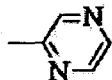
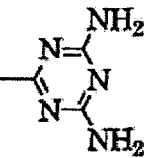
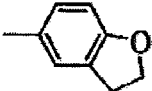
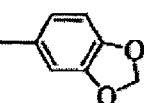
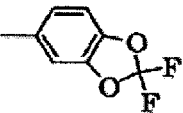
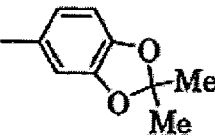
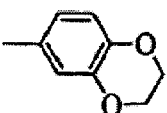
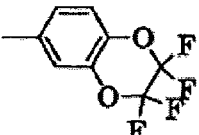
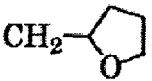
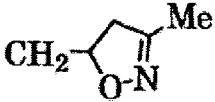
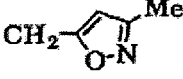
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-152	O		—
V-153	O		—
V-154	O		—
V-155	O		—
V-156	O		—
V-157	O		—
V-158	O		—
V-159	O		—
V-160	O		—
V-161	O		—
V-162	O		—
V-163	O	NH ₂	—

Tabela 54

Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-164	O	NHMe	—
V-165	O	NMe ₂	—
V-166	O	OMe	—
V-167	O	OEt	—
V-168	O	Me	5-F
V-169	O	Me	6-F
V-170	O	Me	7-F
V-171	O	Me	8-F
V-172	O	Me	5-Cl
V-173	O	CH ₂ CH ₂ OMe	5-Cl
V-174	O	Me	6-Cl
V-175	O	CH ₂ CH ₂ OMe	6-Cl
V-176	O	Me	7-Cl
V-177	O	CH ₂ CH ₂ OMe	7-Cl
V-178	O	Me	8-Cl
V-179	O	CH ₂ CH ₂ OMe	8-Cl
V-180	O	Me	7-Me
V-181	O	Me	6-CF ₃
V-182	O	Me	7-CF ₃
V-183	O	Me	6-OH
V-184	O	Me	7-OH
V-185	O	Me	6-OMe
V-186	O	Me	7-OMe
V-187	O	Me	6-OCF ₃
V-188	O	Me	7-OCF ₃
V-189	O	Me	5-SMe
V-190	O	Me	6-SMe
V-191	O	Me	7-SMe
V-192	O	Me	8-SMe
V-193	O	Me	5-SO ₂ Me
V-194	O	Me	6-SO ₂ Me
V-195	O	Me	7-SO ₂ Me
V-196	O	Me	8-SO ₂ Me
V-197	O	Me	6-NO ₂
V-198	O	Me	7-NO ₂
V-199	O	Me	6-NH ₂
V-200	O	Me	7-NH ₂

Tabela 55

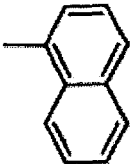
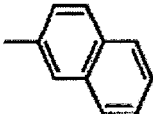
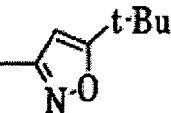
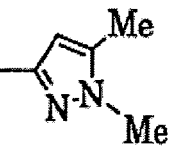
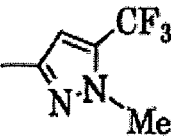
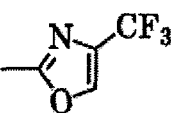
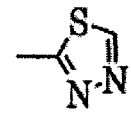
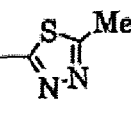
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-201	O	Me	7-CN
V-202	O	Me	6,7-Cl ₂
V-203	O	Me	6,7-Me ₂
V-204	S	Me	—
V-205	O		—
V-206	O		—
V-207	O		—
V-208	O		—
V-209	O		—
V-210	O		—
V-211	O		—
V-212	O		—
V-213	O		—

Tabela 56

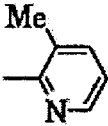
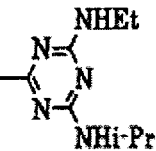
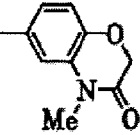
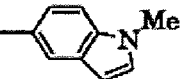
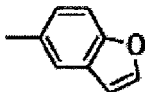
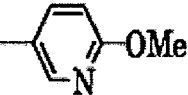
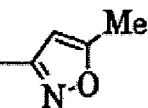
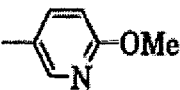
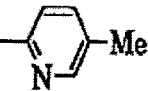
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-214	O		—
V-215	O		—
V-216	O		—
V-217	O		—
V-218	O		—
V-219	O		—
V-220	O	N(Me)C(=O)Ot-Bu	—
V-221	O		5-F
V-222	O	Bn	6-F
V-223	O		6-F
V-224	O	Me	5-CH ₂ OMe
V-225	O		5,7-F ₂
V-226	O		7-Cl
V-227	O	CH ₂ -c-Pr	—
V-228	O	CH ₂ -c-Bu	—
V-229	O	CH ₂ -c-Pen	—
V-230	O	CH ₂ O-c-Pen	—

Tabela 57

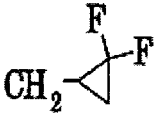
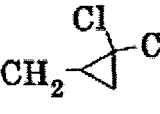
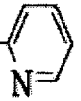
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-231	O	CH ₂ CH ₂ NH ₂	—
V-232	O	CH ₂ CH ₂ NHEt	—
V-233	O	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	—
V-234	O	CH ₂ CH ₂ NEt ₂	—
V-235	O	CH ₂ CH ₂ CHO	—
V-236	O		—
V-237	O		—
V-238	O	CH ₂ OCH ₂ ·c-Pr	—
V-239	O	CH ₂ SPh	—
V-240	O	CH ₂ CH ₂ O- 	—
V-241	O	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	—
V-242	O	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	—
V-243	O	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	—
V-244	O	CH ₂ OCH ₂ Ph	—
V-245	O	CH ₂ SOPh	—
V-246	O	CH ₂ SO ₂ Ph	—
V-247	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SMe	—
V-248	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SOMe	—
V-249	O	CH ₂ CH ₂ CH(OEt) ₂	—
V-250	O	CH ₂ C(Me)=NOMe	—
V-251	O	CH ₂ CH ₂ ON=CMe ₂	—
V-252	O	Me	7·CH=CMe ₂
V-253	O	Me	7·C≡CMe
V-254	O	Me	7·CH ₂ ·c-Pr
V-255	O	Me	7·C(Me)=CF ₂
V-256	O	Me	7· 
V-257	O	Me	7·O·c-Pr

Tabela 58

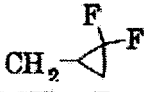
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-258	O	Me	7- 
V-259	O	Me	7-OCH ₂ -c-Pr
V-260	O	Me	7-OCH ₂ OMe
V-261	O	Me	7-OC(=O)Me
V-262	O	Me	7-SOMe
V-263	O	Me	7-SCF ₃
V-264	O	Me	7-SOCH ₂ CF ₃
V-265	O	Me	7-SO ₂ CH ₂ CF ₃
V-266	O	Me	7-NMe ₂
V-267	O	Me	7-NHC(=O)Me
V-268	O	Me	7-CH ₂ OH
V-269	O	Me	7-CH(OEt) ₂
V-270	O	Me	7-CH ₂ SMe
V-271	O	Me	7-CH ₂ SOMe
V-272	O	Me	7-CH ₂ SO ₂ Me
V-273	O	Me	7-CH ₂ SCHF ₂
V-274	O	Me	7-CH ₂ SOCHF ₂
V-275	O	Me	7-CH ₂ SO ₂ CHF ₂
V-276	O	Me	7-CH ₂ CN
V-277	O	Me	7-C(Me)=NOMe
V-278	O	Me	7-C(=O)NH ₂
V-279	O	Me	7- 
V-280	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-F)	—
V-281	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-Cl)	—
V-282	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-NO ₂)	—
V-283	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CN)	—
V-284	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-Me)	—
V-285	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CF ₃)	—
V-286	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-OMe)	—
V-287	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-OCF ₃)	—
V-288	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SMe)	—
V-289	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SO ₂ Me)	—
V-290	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-SCF ₃)	—
V-291	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-CO ₂ Me)	—
V-292	O	CH ₂ OCH ₂ Ph(2-COMe)	—
V-293	O	(2-NO ₂)Bn	—
V-294	O	(2-CN)Bn	—
V-295	O	(3-SMe)Bn	—

Tabela 59

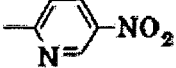
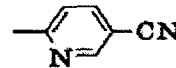
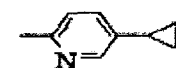
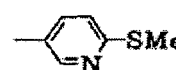
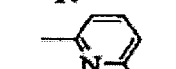
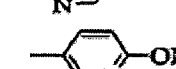
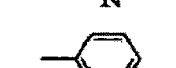
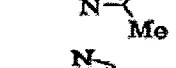
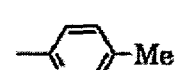
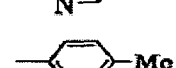
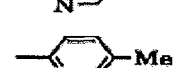
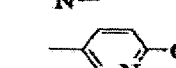
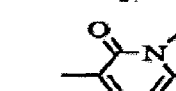
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
V-296	O	(3-SO ₂ Me)Bn	—
V-297	O	(3-SCF ₃)Bn	—
V-298	O	(3-CO ₂ Me)Bn	—
V-299	O	(3-COMe)Bn	—
V-300	O	(3-OMe)Bn	—
V-301	O		—
V-302	O		—
V-303	O		—
V-304	O		—
V-305	O	Et	5-Cl
V-306	O	n-Bu	5-Cl
V-307	O		7-Me
V-308	O		6-CF ₃
V-309	O		—
V-310	O		5-Cl
V-311	O		6-F
V-312	O		—
V-313	O	NHC(=O)O-t-Bu	—
V-314	O	N(Me)C(=O)O-t-Bu	—
V-315	O		5-F
V-316	O		5-Cl
V-317	O		5-Me
V-318	O		5-Me
V-319	O		—

Tabela 60

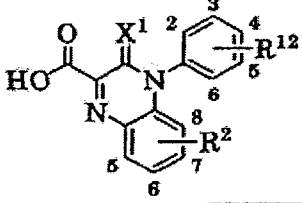
			
Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VI-1	O	—	—
VI-2	O	2-F	—
VI-3	O	3-F	—
VI-4	O	4-F	—
VI-5	O	2-Cl	—
VI-6	O	3-Cl	—
VI-7	O	4-Cl	—
VI-8	O	2-Br	—
VI-9	O	3-Br	—
VI-10	O	4-Br	—
VI-11	O	2-Me	—
VI-12	O	3-Me	—
VI-13	O	4-Me	—
VI-14	O	2-Et	—
VI-15	O	3-Et	—
VI-16	O	4-Et	—
VI-17	O	2-n-Pr	—
VI-18	O	3-n-Pr	—
VI-19	O	4-n-Pr	—
VI-20	O	2-i-Pr	—
VI-21	O	3-i-Pr	—
VI-22	O	4-i-Pr	—
VI-23	O	2-c-Pr	—
VI-24	O	3-c-Pr	—
VI-25	O	4-c-Pr	—
VI-26	O	2-CF ₃	—
VI-27	O	3-CF ₃	—
VI-28	O	4-CF ₃	—
VI-29	O	2-OH	—
VI-30	O	3-OH	—
VI-31	O	4-OH	—
VI-32	O	2-OMe	—
VI-33	O	3-OMe	—
VI-34	O	4-OMe	—
VI-35	O	2-OEt	—
VI-36	O	3-OEt	—

Tabela 61

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VI-37	O	4-OEt	—
VI-38	O	2-O-n-Pr	—
VI-39	O	3-O-n-Pr	—
VI-40	O	4-O-n-Pr	—
VI-41	O	2-O-i-Pr	—
VI-42	O	3-O-i-Pr	—
VI-43	O	4-O-i-Pr	—
VI-44	O	2-O-c-Pr	—
VI-45	O	3-O-c-Pr	—
VI-46	O	4-O-c-Pr	—
VI-47	O	2-OCH ₂ CH=CH ₂	—
VI-48	O	3-OCH ₂ CH=CH ₂	—
VI-49	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	—
VI-50	O	2-OCH ₂ C≡CH	—
VI-51	O	3-OCH ₂ C≡CH	—
VI-52	O	4-OCH ₂ C≡CH	—
VI-53	O	2-OCF ₂	—
VI-54	O	3-OCF ₂	—
VI-55	O	4-OCF ₂	—
VI-56	O	2-OCF ₃	—
VI-57	O	3-OCF ₃	—
VI-58	O	4-OCF ₃	—
VI-59	O	2-OCH ₂ CH ₂ OMe	—
VI-60	O	3-OCH ₂ CH ₂ OMe	—
VI-61	O	4-OCH ₂ CH ₂ OMe	—
VI-62	O	2-OCH ₂ 	—
VI-63	O	3-OCH ₂ 	—
VI-64	O	4-OCH ₂ 	—
VI-65	O	2-OC(=O)Me	—
VI-66	O	3-OC(=O)Me	—
VI-67	O	3-OC(=O)Me	—
VI-68	O	2-SMe	—
VI-69	O	3-SMe	—
VI-70	O	4-SMe	—

Tabela 62

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VI-71	O	2-SO ₂ Me	—
VI-72	O	3-SO ₂ Me	—
VI-73	O	4-SO ₂ Me	—
VI-74	O	2-SCF ₃	—
VI-75	O	3-SCF ₃	—
VI-76	O	4-SCF ₃	—
VI-77	O	2-NO ₂	—
VI-78	O	3-NO ₂	—
VI-79	O	4-NO ₂	—
VI-80	O	2-NH ₂	—
VI-81	O	3-NH ₂	—
VI-82	O	4-NH ₂	—
VI-83	O	2-CN	—
VI-84	O	3-CN	—
VI-85	O	4-CN	—
VI-86	O	2-C(=O)Me	—
VI-87	O	3-C(=O)Me	—
VI-88	O	4-C(=O)Me	—
VI-89	O	2-C(=O)OH	—
VI-90	O	3-C(=O)OH	—
VI-91	O	4-C(=O)OH	—
VI-92	O	2-C(=O)OMe	—
VI-93	O	3-C(=O)OMe	—
VI-94	O	4-C(=O)OMe	—
VI-95	O	2-CH ₂ OMe	—
VI-96	O	3-CH ₂ OMe	—
VI-97	O	4-CH ₂ OMe	—
VI-98	O	2,3-F ₂	—
VI-99	O	2,4-F ₂	—
VI-100	O	2,5-F ₂	—
VI-101	O	2,6-F ₂	—
VI-102	O	3,4-F ₂	—
VI-103	O	3,5-F ₂	—
VI-104	O	2,3-Cl ₂	—
VI-105	O	2,4-Cl ₂	—
VI-106	O	2,5-Cl ₂	—
VI-107	O	2,6-Cl ₂	—
VI-108	O	3,4-Cl ₂	—
VI-109	O	3,5-Cl ₂	—

Tabela 63

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VI-110	O	2-F, 3-OMe	—
VI-111	O	2-Cl, 3-OMe	—
VI-112	O	2-Me, 3-OMe	—
VI-113	O	2,3-(OMe) ₂	—
VI-114	O	3-OMe, 4-F	—
VI-115	O	3-OMe, 4-Cl	—
VI-116	O	3-OMe, 4-Me	—
VI-117	O	3,4-(OMe) ₂	—
VI-118	O	3-OMe, 5-F	—
VI-119	O	3-OMe, 5-Cl	—
VI-120	O	3-OMe, 5-Me	—
VI-121	O	3,5-(OMe) ₂	—
VI-122	O	2-F, 4-OMe	—
VI-123	O	2-Cl, 4-OMe	—
VI-124	O	2-Me, 4-OMe	—
VI-125	O	2,4-(OMe) ₂	—
VI-126	O	3-F, 4-OMe	—
VI-127	O	3-Cl, 4-OMe	—
VI-128	O	3-Me, 4-OMe	—
VI-129	O	2-F, 5-OMe	—
VI-130	O	2-Cl, 5-OMe	—
VI-131	O	2-Me, 5-OMe	—
VI-132	O	2,5-(OMe) ₂	—
VI-133	O	3,4,5-(OMe) ₃	—
VI-134	O	4-OMe	5-F
VI-135	O	4-OMe	6-F
VI-136	O	4-OMe	7-F
VI-137	O	4-OMe	8-F
VI-138	O	—	5-Cl
VI-139	O	—	6-Cl
VI-140	O	—	7-Cl
VI-141	O	—	8-Cl
VI-142	O	4-OMe	5-Cl
VI-143	O	4-OMe	6-Cl
VI-144	O	4-OMe	7-Cl
VI-145	O	4-OMe	8-Cl
VI-146	S	—	—
VI-147	O	4-OCH ₂ CN	—
VI-148	O	3-OCH ₂ -c-Pr	—

Tabela 64

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VI-149	O	3-OCH ₂ CF ₃	—
VI-150	O	4-OCH ₂ -c-Pr	—
VI-151	O	4-OCH ₂ CF ₃	—
VI-152	O	4-NMe ₂	—
VI-153	O	3,4-Me ₂	—
VI-154	O	2-F, 4-Me	—
VI-155	O	3-F, 4-Me	—
VI-156	O	3-Me, 4-F	—
VI-157	O	2-Cl, 4-Me	—
VI-158	O	3-Cl, 4-Me	—
VI-159	O	3-OEt, 4-OMe	—
VI-160	O	2,3,4-(OMe) ₃	—
VI-161	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	—
VI-162	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	—
VI-163	O	3,5-Cl ₂ , 4-OMe	—
VI-164	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	—
VI-165	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	—
VI-166	O	3,4-(CH ₂ OCH ₂)-	—
VI-167	O	3,4-(OCH ₂ O)-	7-F
VI-168	O	2,3-(OCH ₂ CH ₂ O)-	—
VI-169	O	3,4-(OCH ₂ CH(Me)O)-	—
VI-170	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O)-	—
VI-171	O	—	5-F
VI-172	O	3,4,5-(OMe) ₃	5-F
VI-173	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	5-F
VI-174	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	5-F
VI-175	O	—	6-F
VI-176	O	3,4,5-(OMe) ₃	6-F
VI-177	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-F
VI-178	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-F
VI-179	O	—	7-F
VI-180	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	7-F
VI-181	O	—	8-F
VI-182	O	—	5-Me
VI-183	O	4-OMe	5-Me
VI-184	O	4-OMe	6-Me
VI-185	O	4-OMe	7-Me
VI-186	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-Me

Tabela 65

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VI-187	O	—	6·CF ₃
VI-188	O	—	6·OMe
VI-189	O	4·OMe	6·OMe
VI-190	O	—	7·OMe
VI-191	O	4·OMe	7·OMe
VI-192	O	2,5-F ₂ , 4·OMe	7·OMe
VI-193	O	3,5-F ₂ , 4·OMe	7·OMe
VI-194	O	—	8·OMe
VI-195	O	4·OMe	8·OMe
VI-196	O	4·OMe	5,6-F ₂
VI-197	O	4·OMe	5,7-F ₂
VI-198	O	—	6,7-F ₂
VI-199	O	—	6,8-F ₂
VI-200	O	4·OMe	5,7-Cl ₂
VI-201	O	4·OMe	6-F, 7·OMe
VI-202	O	—	7-c-Pr
VI-203	O	—	7-OCH ₂ CH=CH ₂
VI-204	O	—	7-OCH ₂ C≡CH
VI-205	O	—	7-NHMe
VI-206	O	—	7-C(=O)H
VI-207	O	—	6-C(=O)Me
VI-208	O	—	7-C(=O)OH
VI-209	O	—	7-C(=O)OMe
VI-210	O	—	7-C(=O)OEt
VI-211	O	—	7-C(=O)NHNe
VI-212	O	—	7-C(=O)NMe ₂
VI-213	O	—	6,7-(OCH ₂ CH ₂ O)·
VI-214	O	—	6,7-(OCH ₂ O)·
VI-215	O	4·OMe	6,7-(OCH ₂ CH ₂ O)·
VI-216	O	4·OMe	6,7-(OCH ₂ O)·
VI-217	O	2-CONHMe	—
VI-218	O	2-CONMe ₂	—
VI-219	O	2-NHCOMe	—
VI-220	O	4-CH ₂ -c-Pr	—
VI-221	O	4-CH=CH ₂	—
VI-222	O	4-C≡CMe	—
VI-223	O	3-CH=CF ₂	—

Tabela 66

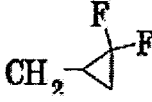
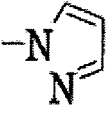
Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VI-224	O	3- 	—
VI-225	O	4- 	—
VI-226	O	4-CH ₂ OH	—
VI-227	O	4-CH ₂ SMe	—
VI-228	O	4-CH ₂ SOMe	—
VI-229	O	4-CH ₂ SO ₂ Me	—
VI-230	O	4-CH ₂ SCHF ₂	—
VI-231	O	4-CH ₂ SOCHF ₂	—
VI-232	O	4-CH ₂ SO ₂ CHF ₂	—
VI-233	O	4-CH ₂ CN	—
VI-234	O	4-NHMe	—
VI-235	O	4-OCH ₂ OCH ₂ CF ₃	—
VI-236	O	4-C(Me)=NOMe	—
VI-237	O	2-CONH ₂	—
VI-238	O	4- 	—
VI-239	O	3-F, 4-OMe	5-Cl
VI-240	O	4-OMe	5,6,8-F ₃ , 7-OMe
VI-241	O	—	7-CF ₃
VI-242	O	4-F	7-OMe
VI-243	O	4-OCHF ₂	7-OMe
VI-244	O	4-Me	7-OMe
VI-245	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6,8-F ₂
VI-246	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	8-F
VI-247	O	4-OMe	5-Br
VI-248	O	4-F	5-F
VI-249	O	3-F, 4-OEt	—

Tabela 67

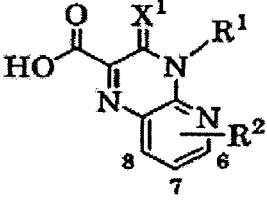
			
Composto No.	X¹	R¹	R²
VII-1	O	H	—
VII-2	O	Me	—
VII-3	O	Et	—
VII-4	O	n-Pr	—
VII-5	O	i-Pr	—
VII-6	O	c-Pr	—
VII-7	O	n-Bu	—
VII-8	O	s-Bu	—
VII-9	O	i-Bu	—
VII-10	O	t-Bu	—
VII-11	O	c-Bu	—
VII-12	O	n-Pen	—
VII-13	O	c-Pen	—
VII-14	O	n-Hex	—
VII-15	O	c-Hex	—
VII-16	O	n-C ₇ H ₁₅	—
VII-17	O	n-C ₈ H ₁₇	—
VII-18	O	n-C ₉ H ₁₉	—
VII-19	O	n-C ₁₀ H ₂₁	—
VII-20	O	n-C ₁₁ H ₂₃	—
VII-21	O	n-C ₁₂ H ₂₅	—
VII-22	O	CH ₂ CH=CH ₂	—
VII-23	O	CH ₂ C≡CH	—
VII-24	O	CH ₂ CF ₃	—
VII-25	O	CH ₂ CH ₂ F	—
VII-26	O	CH ₂ CH ₂ Cl	—
VII-27	O	CH ₂ CH ₂ CF ₃	—
VII-28	O	CH ₂ CH=CCl ₂	—
VII-29	O	CH ₂ OMe	—
VII-30	O	CH ₂ OEt	—
VII-31	O	CH(Me)OMe	—
VII-32	O	CH(Me)OEt	—
VII-33	O	CH ₂ OPh	—

Tabela 68

Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
VII-34	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	—
VII-35	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—
VII-36	O	CH(Me)OCH ₂ CF ₃	—
VII-37	O	CH ₂ OCH ₂ - 	—
VII-38	O	CH(Me)OCH ₂ - 	—
VII-39	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—
VII-40	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	—
VII-41	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	—
VII-42	O	CH ₂ SMe	—
VII-43	O	CH ₂ SMe	—
VII-44	O	CH ₂ SEt	—
VII-45	O	CH ₂ S-n-Pr	—
VII-46	O	CH(Me)SMe	—
VII-47	O	CH(Me)SEt	—
VII-48	O	CH(Me)S-n-Pr	—
VII-49	O	CH ₂ SOMe	—
VII-50	O	CH ₂ SOEt	—
VII-51	O	CH ₂ SO-n-Pr	—
VII-52	O	CH ₂ SO ₂ Me	—
VII-53	O	CH ₂ SO ₂ Et	—
VII-54	O	CH ₂ SO ₂ -n-Pr	—
VII-55	O	CH(Me)SO ₂ Me	—
VII-56	O	CH(Me)SO ₂ Et	—
VII-57	O	CH(Me)SO ₂ -n-Pr	—
VII-58	O	CH ₂ CH ₂ OH	—
VII-59	O	CH ₂ CH ₂ OMe	—
VII-60	O	CH ₂ CH ₂ OEt	—
VII-61	O	CH(Me)CH ₂ OMe	—
VII-62	O	CH ₂ CH ₂ SMe	—
VII-63	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—
VII-64	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	—
VII-65	O	CH ₂ C(=O)Me	—
VII-66	O	CH ₂ C(=O)OMe	—

Tabela 69

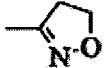
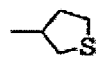
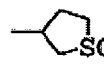
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
VII-67	O	CH ₂ C(=O)OEt	—
VII-68	O	CH ₂ C(=O)On-Pr	—
VII-69	O	CH ₂ C(=O)Oi-Pr	—
VII-70	O	CH ₂ C(=O)Ot-Bu	—
VII-71	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	—
VII-72	O	CH ₂ C(=O)—N 	—
VII-73	O	CH ₂ CN	—
VII-74	O	CH ₂ CH ₂ CN	—
VII-75	O	CH(Me)CH ₂ CN	—
VII-76	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	—
VII-77	O	CH ₂ CH ₂ NO ₂	—
VII-78	O	Bn	—
VII-79	O	(2-F)Bn	—
VII-80	O	(3-F)Bn	—
VII-81	O	(4-F)Bn	—
VII-82	O	(2-Cl)Bn	—
VII-83	O	(3-Cl)Bn	—
VII-84	O	(4-Cl)Bn	—
VII-85	O	(2-Me)Bn	—
VII-86	O	(3-Me)Bn	—
VII-87	O	(4-Me)Bn	—
VII-88	O	(2-CF ₃)Bn	—
VII-89	O	(3-CF ₃)Bn	—
VII-90	O	(4-CF ₃)Bn	—
VII-91	O	(2-OMe)Bn	—
VII-92	O	(3-OMe)Bn	—
VII-93	O	(4-OMe)Bn	—
VII-94	O	(2,4-(OMe) ₂)Bn	—
VII-95	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	—
VII-96	O	(3,5-(OMe) ₂)Bn	—
VII-97	O	CH(Me)Ph	—
VII-98	O		—
VII-99	O		—
VII-100	O		—

Tabela 70

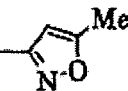
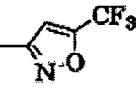
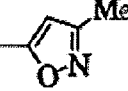
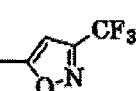
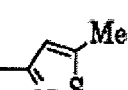
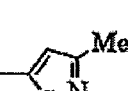
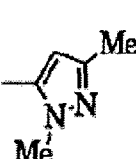
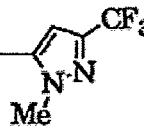
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
VII-101	O		—
VII-102	O		—
VII-103	O		—
VII-104	O		—
VII-105	O		—
VII-106	O		—
VII-107	O		—
VII-108	O		—
VII-109	O		—
VII-110	O		—
VII-111	O		—
VII-112	O		—
VII-113	O		—
VII-114	O		—

Tabela 71

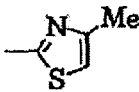
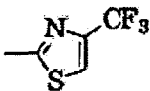
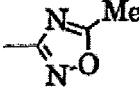
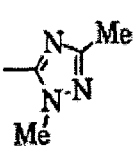
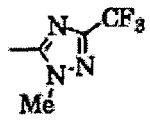
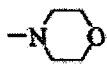
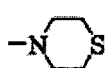
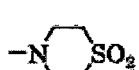
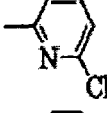
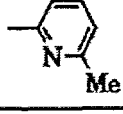
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
VII-115	O		—
VII-116	O		—
VII-117	O		—
VII-118	O		—
VII-119	O		—
VII-120	O		—
VII-121	O		—
VII-122	O		—
VII-123	O		—
VII-124	O		—
VII-125	O		—
VII-126	O		—
VII-127	O		—
VII-128	O		—

Tabela 72

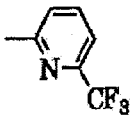
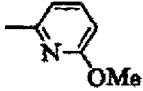
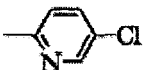
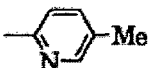
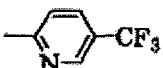
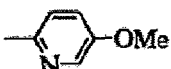
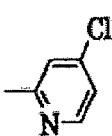
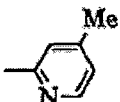
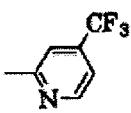
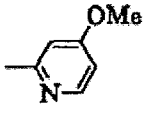
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
VII-129	O		—
VII-130	O		—
VII-131	O		—
VII-132	O		—
VII-133	O		—
VII-134	O		—
VII-135	O		—
VII-136	O		—
VII-137	O		—
VII-138	O		—
VII-139	O		—
VII-140	O		—
VII-141	O		—

Tabela 73

Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
VII-142	O		—
VII-143	O		—
VII-144	O		—
VII-145	O		—
VII-146	O		—
VII-147	O		—
VII-148	O		—
VII-149	O		—
VII-150	O		—
VII-151	O		—
VII-152	O		—
VII-153	O		—
VII-154	O		—

Tabela 74

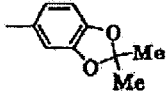
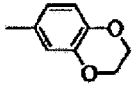
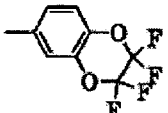
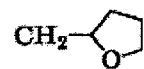
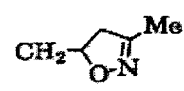
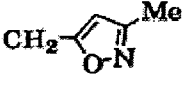
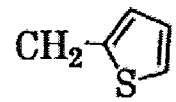
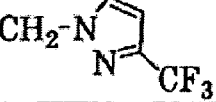
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
VII-155	O		—
VII-156	O		—
VII-157	O		—
VII-158	O		—
VII-159	O		—
VII-160	O		—
VII-161	O	NH ₂	—
VII-162	O	NHMe	—
VII-163	O	NMe ₂	—
VII-164	O	OMe	—
VII-165	O	OEt	—
VII-166	O	Me	6-F
VII-167	O	Me	6-Cl
VII-168	O	Me	6-OMe
VII-169	S	Me	—
VII-170	O	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	—
VII-171	O	CH ₂ CH ₂ CH=C(Me) ₂	—
VII-172	O	CH ₂ CH ₂ C≡CH	—
VII-173	O	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	—
VII-174	O	CH(Me)C(=O)Ot-Bu	—
VII-175	O	(2-OCHF ₂)Bn	—
VII-176	O	CH ₂ CH ₂ Ph	—
VII-177	O		—
VII-178	O		—

Tabela 75

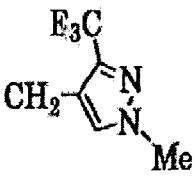
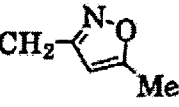
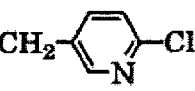
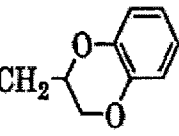
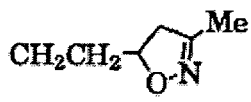
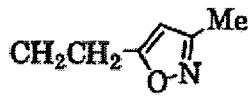
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
VII-179	O		—
VII-180	O		—
VII-181	O		—
VII-182	O		—
VII-183	O		—
VII-184	O		—
VII-185	O	Bn	8-Me
VII-186	O	Bn	7-Me
VII-187	O	Bn	6-Me
VII-188	O	Bn	6-OMe

Tabela 76

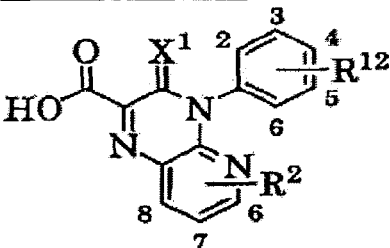
			
Composto No.	X¹	R¹²	R²
VIII-1	O	—	—
VIII-2	O	2-F	—
VIII-3	O	3-F	—
VIII-4	O	4-F	—
VIII-5	O	2-Cl	—
VIII-6	O	3-Cl	—
VIII-7	O	4-Cl	—
VIII-8	O	2-Br	—
VIII-9	O	3-Br	—
VIII-10	O	4-Br	—
VIII-11	O	2-Me	—
VIII-12	O	3-Me	—
VIII-13	O	4-Me	—
VIII-14	O	2-Et	—
VIII-15	O	3-Et	—
VIII-16	O	4-Et	—
VIII-17	O	2-n-Pr	—
VIII-18	O	3-n-Pr	—
VIII-19	O	4-n-Pr	—
VIII-20	O	2-i-Pr	—
VIII-21	O	3-i-Pr	—
VIII-22	O	4-i-Pr	—
VIII-23	O	2-c-Pr	—
VIII-24	O	3-c-Pr	—
VIII-25	O	4-c-Pr	—
VIII-26	O	2-CF₃	—
VIII-27	O	3-CF₃	—
VIII-28	O	4-CF₃	—
VIII-29	O	2-OH	—
VIII-30	O	3-OH	—
VIII-31	O	4-OH	—

Tabela 77

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-32	O	2-OMe	—
VIII-33	O	3-OMe	—
VIII-34	O	4-OMe	—
VIII-35	O	2-OEt	—
VIII-36	O	3-OEt	—
VIII-37	O	4-OEt	—
VIII-38	O	2-O-n-Pr	—
VIII-39	O	3-O-n-Pr	—
VIII-40	O	4-O-n-Pr	—
VIII-41	O	2-O-i-Pr	—
VIII-42	O	3-O-i-Pr	—
VIII-43	O	4-O-i-Pr	—
VIII-44	O	2-O-c-Pr	—
VIII-45	O	3-O-c-Pr	—
VIII-46	O	4-O-c-Pr	—
VIII-47	O	2-OCH ₂ CH=CH ₂	—
VIII-48	O	3-OCH ₂ CH=CH ₂	—
VIII-49	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	—
VIII-50	O	2-OCH ₂ C≡CH	—
VIII-51	O	3-OCH ₂ C≡CH	—
VIII-52	O	4-OCH ₂ C≡CH	—
VIII-53	O	2-OCHF ₂	—
VIII-54	O	3-OCHF ₂	—
VIII-55	O	4-OCHF ₂	—
VIII-56	O	2-OCF ₃	—
VIII-57	O	3-OCF ₃	—
VIII-58	O	4-OCF ₃	—
VIII-59	O	2-OCH ₂ CH ₂ OMe	—
VIII-60	O	3-OCH ₂ CH ₂ OMe	—
VIII-61	O	4-OCH ₂ CH ₂ OMe	—
VIII-62	O	2-OCH ₂ 	—
VIII-63	O	3-OCH ₂ 	—
VIII-64	O	4-OCH ₂ 	—

Tabela 78

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-65	O	2-OC(=O)Me	—
VIII-66	O	3-OC(=O)Me	—
VIII-67	O	3-OC(=O)Me	—
VIII-68	O	2-SMe	—
VIII-69	O	3-SMe	—
VIII-70	O	4-SMe	—
VIII-71	O	2-SO ₂ Me	—
VIII-72	O	3-SO ₂ Me	—
VIII-73	O	4-SO ₂ Me	—
VIII-74	O	2-SCF ₃	—
VIII-75	O	3-SCF ₃	—
VIII-76	O	4-SCF ₃	—
VIII-77	O	2-NO ₂	—
VIII-78	O	3-NO ₂	—
VIII-79	O	4-NO ₂	—
VIII-80	O	2-NH ₂	—
VIII-81	O	3-NH ₂	—
VIII-82	O	4-NH ₂	—
VIII-83	O	2-CN	—
VIII-84	O	3-CN	—
VIII-85	O	4-CN	—
VIII-86	O	2-C(=O)Me	—
VIII-87	O	3-C(=O)Me	—
VIII-88	O	4-C(=O)Me	—
VIII-89	O	2-C(=O)OH	—
VIII-90	O	3-C(=O)OH	—
VIII-91	O	4-C(=O)OH	—
VIII-92	O	2-C(=O)OMe	—
VIII-93	O	3-C(=O)OMe	—
VIII-94	O	4-C(=O)OMe	—
VIII-95	O	2-CH ₂ OMe	—
VIII-96	O	3-CH ₂ OMe	—
VIII-97	O	4-CH ₂ OMe	—
VIII-98	O	2,3-F ₂	—
VIII-99	O	2,4-F ₂	—

Tabela 79

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-100	O	2,5-F ₂	—
VIII-101	O	2,6-F ₂	—
VIII-102	O	3,4-F ₂	—
VIII-103	O	3,5-F ₂	—
VIII-104	O	2,3-Cl ₂	—
VIII-105	O	2,4-Cl ₂	—
VIII-106	O	2,5-Cl ₂	—
VIII-107	O	2,6-Cl ₂	—
VIII-108	O	3,4-Cl ₂	—
VIII-109	O	3,5-Cl ₂	—
VIII-110	O	2-F, 3-OMe	—
VIII-111	O	2-Cl, 3-OMe	—
VIII-112	O	2-Me, 3-OMe	—
VIII-113	O	2,3-(OMe) ₂	—
VIII-114	O	3-OMe, 4-F	—
VIII-115	O	3-OMe, 4-Cl	—
VIII-116	O	3-OMe, 4-Me	—
VIII-117	O	3,4-(OMe) ₂	—
VIII-118	O	3-OMe, 5-F	—
VIII-119	O	3-OMe, 5-Cl	—
VIII-120	O	3-OMe, 5-Me	—
VIII-121	O	3,5-(OMe) ₂	—
VIII-122	O	2-F, 4-OMe	—
VIII-123	O	2-Cl, 4-OMe	—
VIII-124	O	2-Me, 4-OMe	—
VIII-125	O	2,4-(OMe) ₂	—
VIII-126	O	3-F, 4-OMe	—
VIII-127	O	3-Cl, 4-OMe	—
VIII-128	O	3-Me, 4-OMe	—
VIII-129	O	2-F, 5-OMe	—
VIII-130	O	2-Cl, 5-OMe	—
VIII-131	O	2-Me, 5-OMe	—
VIII-132	O	2,5-(OMe) ₂	—
VIII-133	O	3,4,5-(OMe) ₃	—
VIII-134	O	—	6-F
VIII-135	O	4-OMe	6-F
VIII-136	O	—	6-Cl

Tabela 80

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-137	O	4-OMe	6-Cl
VIII-138	O	—	6-OMe
VIII-139	O	4-OMe	6-OMe
VIII-140	S	—	—
VIII-141	S	4-OMe	—
VIII-142	O	2-F, 5-CF ₃	—
VIII-143	O	3-CF ₃ , 4-F	—
VIII-144	O	2-F, 3-CF ₃	—
VIII-145	O	3-F, 5-CF ₃	—
VIII-146	O	2,3-(Me) ₂	—
VIII-147	O	2,4-(Me) ₂	—
VIII-148	O	2,5-(Me) ₂	—
VIII-149	O	2,6-(Me) ₂	—
VIII-150	O	3,4-(Me) ₂	—
VIII-151	O	3,5-(Me) ₂	—
VIII-152	O	3,5-(CF ₃) ₂	—
VIII-153	O	2,6-(OMe) ₂	—
VIII-154	O	2-F, 3-Cl	—
VIII-155	O	2-F, 4-Cl	—
VIII-156	O	2-F, 5-Cl	—
VIII-157	O	3-F, 4-Cl	—
VIII-158	O	4-F, 2-Cl	—
VIII-159	O	4-F, 3-Cl	—
VIII-160	O	2-F, 3-Me	—
VIII-161	O	2-F, 4-Me	—
VIII-162	O	2-F, 5-Me	—
VIII-163	O	3-F, 2-Me	—
VIII-164	O	3-F, 4-Me	—
VIII-165	O	3-F, 5-Me	—
VIII-166	O	4-F, 2-Me	—
VIII-167	O	4-F, 3-Me	—
VIII-168	O	5-F, 2-Me	—
VIII-169	O	2-F, 4-CF ₃	—
VIII-170	O	3-F, 4-CF ₃	—
VIII-171	O	4-F, 2-CF ₃	—
VIII-172	O	3-F, 2-OMe	—
VIII-173	O	4-F, 2-OMe	—

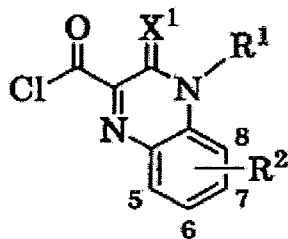
Tabela 81

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
VIII-174	O	5-F, 2-OMe	—
VIII-175	O	2-F, 4-OCHF ₂	—
VIII-176	O	3-F, 4-OCHF ₂	—
VIII-177	O	4-F, 2-OCHF ₂	—
VIII-178	O	4-F, 3-CN	—
VIII-179	O	2-Cl, 4-Me	—
VIII-180	O	3-Cl, 4-Me	—
VIII-181	O	3-Cl, 4-OCHF ₂	—
VIII-182	O	4-Me, 3-CF ₃	—
VIII-183	O	4-Me, 2-OMe	—
VIII-184	O	3-Me, 4-CN	—
VIII-185	O	4-Me, 3-CN	—
VIII-186	O	2,3,4-F ₃	—
VIII-187	O	2,3,5-F ₃	—
VIII-188	O	2,4,5-F ₃	—
VIII-189	O	3,4,5-F ₃	—
VIII-190	O	2,3-F ₂ , 4-Me	—
VIII-191	O	2,6-F ₂ , 4-OMe	—
VIII-192	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	—
VIII-193	O	4-F, 2-Cl, 5-Me	—
VIII-194	O	—	7-Cl
VIII-195	O	—	6-Me
VIII-196	O	—	7-Me
VIII-197	O	—	8-Me
VIII-198	O	3-Me	8-Me
VIII-199	O	3-CF ₃	8-Me
VIII-200	O	4-OMe	8-Me
VIII-201	O	3-F, 4-Me	8-Me
VIII-202	O	3-F, 4-OMe	8-Me
VIII-203	O	—	8-OMe
VIII-204	O	3-CF ₃	8-OMe
VIII-205	O	3-F, 4-Me	8-Cl
VIII-206	O	3-F, 4-Me	6-F
VIII-207	O	3-F, 4-Me	6-Cl
VIII-208	O	3-F, 4-Me	7-Me
VIII-209	O	3-F, 4-Me	6-Me
VIII-210	O	—	8-Cl
VIII-211	O	3-F, 4-Me	6-OMe
VIII-212	O	3-OEt	—
VIII-213	O	4-OEt	—
VIII-214	O	4-OMe	8-Cl
VIII-215	O	—	6-SMe
VIII-216	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-OMe
VIII-217	O	3-F, 4-OEt	—
VIII-218	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Cl

Exemplos específicos preferidos do composto representado pela fórmula [J1] e fórmula [J2] que são intermediários de produção da presente invenção será mostrado na seguinte tabela 82 a Tabela 123. Entretanto, o composto não se destina a ser limitado a estes compostos como

5 no caso do composto da presente invenção.

Tabela 82



Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
IX-1	O	Me	—
IX-2	O	Et	—
IX-3	O	n-Pr	—
IX-4	O	i-Pr	—
IX-5	O	c-Pr	—
IX-6	O	n-Bu	—
IX-7	O	t-Bu	—
IX-8	O	c-Pen	—
IX-9	O	n-Hex	—
IX-10	O	CH ₂ CH=CH ₂	—
IX-11	O	CH ₂ C≡CH	—
IX-12	O	CH ₂ CF ₃	—
IX-13	O	CH ₂ OMe	—
IX-14	O	CH ₂ OEt	—
IX-15	O	CH ₂ OPh	—
IX-16	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	—
IX-17	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—
IX-18	O	CH ₂ OCH ₂ - 	—
IX-19	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—
IX-20	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	—
IX-21	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	—
IX-22	O	CH ₂ SMe	—
IX-23	O	CH ₂ SEt	—
IX-24	O	CH ₂ SO ₂ Me	—
IX-25	O	CH ₂ SO ₂ Et	—
IX-26	O	CH ₂ CH ₂ OMe	—
IX-27	O	CH(Me)CH ₂ OMe	—
IX-28	O	CH ₂ CH ₂ SMe	—
IX-29	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—
IX-30	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	—

Tabela 83

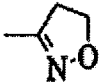
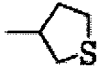
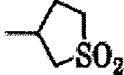
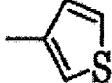
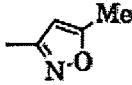
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
IX-31	O	CH ₂ C(=O)Me	—
IX-32	O	CH ₂ C(=O)O-t-Bu	—
IX-33	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	—
IX-34	O	CH ₂ C(=O)-N 	—
IX-35	O	CH ₂ CN	—
IX-36	O	CH ₂ CH ₂ CN	—
IX-37	O	Bn	—
IX-38	O	(2-Cl)Bn	—
IX-39	O	(3-Cl)Bn	—
IX-40	O	(4-Cl)Bn	—
IX-41	O	(2-OMe)Bn	—
IX-42	O	(3-OMe)Bn	—
IX-43	O	(4-OMe)Bn	—
IX-44	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	—
IX-45	O		—
IX-46	O		—
IX-47	O		—
IX-48	O		—
IX-49	O		—
IX-50	O		—

Tabela 84

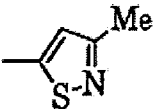
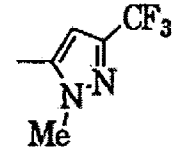
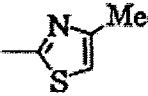
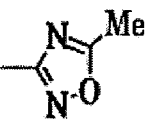
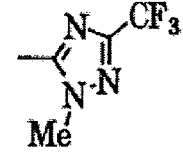
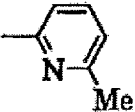
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
IX-51	O		—
IX-52	O		—
IX-53	O		—
IX-54	O		—
IX-55	O		—
IX-56	O		—
IX-57	O		—
IX-58	O		—
IX-59	O		—
IX-60	O		—

Tabela 85

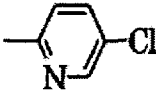
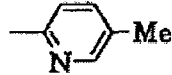
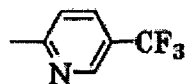
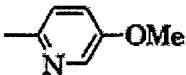
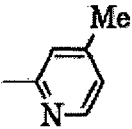
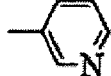
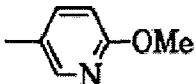
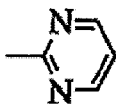
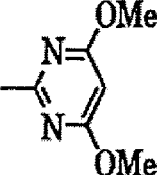
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
IX-61	O		—
IX-62	O		—
IX-63	O		—
IX-64	O		—
IX-65	O		—
IX-66	O		—
IX-67	O		—
IX-68	O		—
IX-69	O		—
IX-70	O		—

Tabela 86

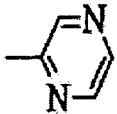
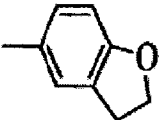
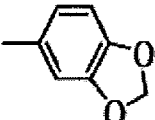
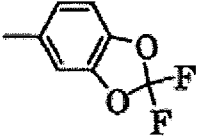
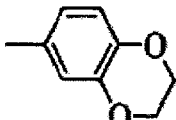
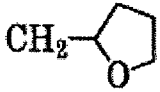
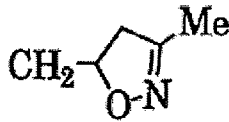
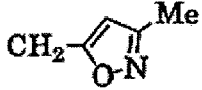
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
IX-71	O		—
IX-72	O		—
IX-73	O		—
IX-74	O		—
IX-75	O		—
IX-76	O		—
IX-77	O		—
IX-78	O		—
IX-79	O	NHMe	—
IX-80	O	Me	6-F
IX-81	O	Me	7-F
IX-82	O	Me	5-Cl
IX-83	O	Me	6-Cl
IX-84	O	Me	7-Cl
IX-85	O	Me	8-Cl

Tabela 87

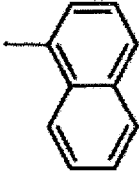
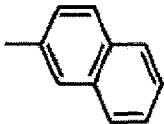
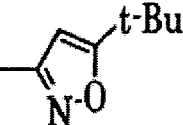
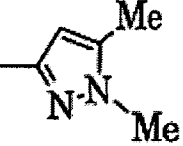
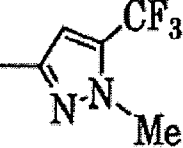
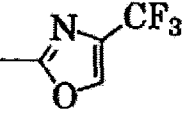
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
IX-86	O	CH ₂ CH ₂ OMe	8-Cl
IX-87	O	Me	7-OMe
IX-88	O	Me	5-SMe
IX-89	O	Me	7-SMe
IX-90	O	Me	5-SO ₂ Me
IX-91	O	Me	7-SO ₂ Me
IX-92	O	Me	6-NO ₂
IX-93	O	Me	7-NO ₂
IX-94	S	Me	—
IX-95	O		—
IX-96	O		—
IX-97	O		—
IX-98	O		—
IX-99	O		—
IX-100	O		—

Tabela 88

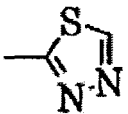
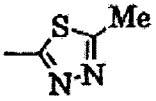
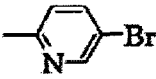
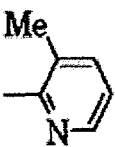
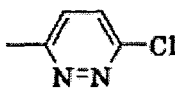
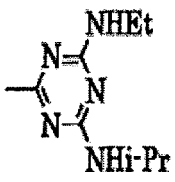
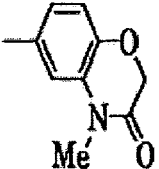
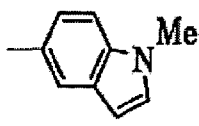
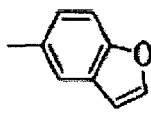
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
IX-101	O		—
IX-102	O		—
IX-103	O		—
IX-104	O		—
IX-105	O		—
IX-106	O		—
IX-107	O		—
IX-108	O		—
IX-109	O		—
IX-110	O	N(Me)C(=O)Ot-Bu	—

Tabela 89

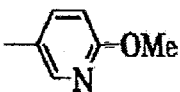
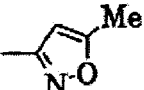
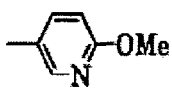
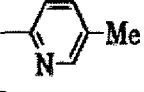
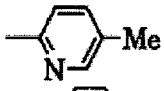
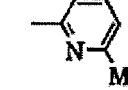
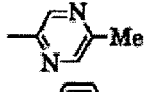
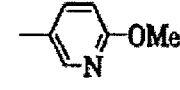
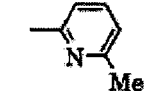
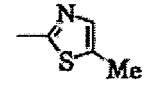
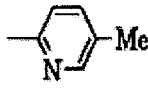
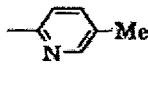
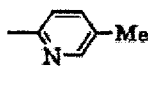
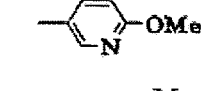
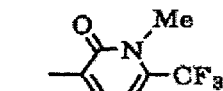
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
IX-111	O		5-F
IX-112	O	Bn	6-F
IX-113	O		6-F
IX-114	O	Me	5-CH ₂ OMe
IX-115	O		5,7-F ₂
IX-116	O		7-Cl
IX-117	O	Et	5-Cl
IX-118	O	n-Bu	5-Cl
IX-119	O		7-Me
IX-120	O		6-CF ₃
IX-121	O		—
IX-122	O		5-Cl
IX-123	O		6-F
IX-124	O		—
IX-125	O		5-F
IX-126	O		5-Cl
IX-127	O		5-Me
IX-128	O		5-Me
IX-129	O		—

Tabela 90

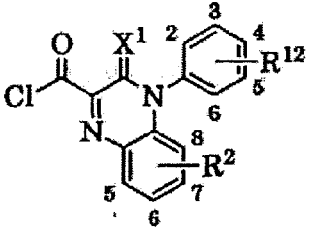
			
Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
X-1	O	—	—
X-2	O	2-F	—
X-3	O	3-F	—
X-4	O	4-F	—
X-5	O	2-Cl	—
X-6	O	3-Cl	—
X-7	O	4-Cl	—
X-8	O	3-Me	—
X-9	O	4-Me	—
X-10	O	3-Et	—
X-11	O	4-Et	—
X-12	O	3-i-Pr	—
X-13	O	4-c-Pr	—
X-14	O	3-CF ₃	—
X-15	O	4-CF ₃	—
X-16	O	4-OH	—
X-17	O	2-OMe	—
X-18	O	3-OMe	—
X-19	O	4-OMe	—
X-20	O	3-OEt	—
X-21	O	4-OEt	—
X-22	O	3-O-n-Pr	—
X-23	O	3-O-i-Pr	—
X-24	O	4-O-i-Pr	—
X-25	O	4-OCH ₂ CH=CH ₂	—
X-26	O	4-OCH ₂ C≡CH	—

Tabela 91

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
X-27	O	3-OCHF ₂	—
X-28	O	4-OCHF ₂	—
X-29	O	3-OCF ₃	—
X-30	O	4-OCH ₂ - 	—
X-31	O	3-SMe	—
X-32	O	4-SMe	—
X-33	O	3-SO ₂ Me	—
X-34	O	4-SO ₂ Me	—
X-35	O	2-NO ₂	—
X-36	O	3-NO ₂	—
X-37	O	4-NO ₂	—
X-38	O	3-CN	—
X-39	O	4-CN	—
X-40	O	4-C(=O)Me	—
X-41	O	4-C(=O)OMe	—
X-42	O	4-CH ₂ OMe	—
X-43	O	3-OMe, 4-Cl	—
X-44	O	3-OMe, 4-Me	—
X-45	O	3,4-(OMe) ₂	—
X-46	O	3,5-(OMe) ₂	—
X-47	O	2-F, 4-OMe	—
X-48	O	2-Cl, 4-OMe	—
X-49	O	2,4-(OMe) ₂	—
X-50	O	3-F, 4-OMe	—
X-51	O	3-Cl, 4-OMe	—
X-52	O	3-Me, 4-OMe	—
X-53	O	3,4,5-(OMe) ₃	—
X-54	O	4-OMe	5-F
X-55	O	4-OMe	6-F
X-56	O	4-OMe	7-F

Tabela 92

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
X-57	O	4-OMe	8-F
X-58	O	—	5-Cl
X-59	O	—	8-Cl
X-60	O	4-OMe	5-Cl
X-61	O	4-OMe	6-Cl
X-62	O	4-OMe	7-Cl
X-63	O	4-OMe	8-Cl
X-64	O	4-OCH ₂ CN	—
X-65	O	4-OCH ₂ -c-Pr	—
X-66	O	4-OCH ₂ CF ₃	—
X-67	O	4-NMe ₂	—
X-68	O	3,4-Me ₂	—
X-69	O	2-F, 4-Me	—
X-70	O	3-F, 4-Me	—
X-71	O	3-Me, 4-F	—
X-72	O	2-Cl, 4-Me	—
X-73	O	3-Cl, 4-Me	—
X-74	O	3-OEt, 4-OMe	—
X-75	O	2,3,4-(OMe) ₃	—
X-76	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	—
X-77	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	—
X-78	O	3,5-Cl ₂ , 4-OMe	—
X-79	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	—
X-80	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	—
X-81	O	3,4-(CH ₂ OCH ₂)-	—
X-82	O	3,4-(OCH ₂ O)-	7-F
X-83	O	2,3-(OCH ₂ CH ₂ O)-	—
X-84	O	3,4-(OCH ₂ CH(Me)O)-	—
X-85	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O)-	—

Tabela 93

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
X-86	O	—	5-F
X-87	O	3,4,5-(OMe) ₃	5-F
X-88	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	5-F
X-89	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	5-F
X-90	O	—	6-F
X-91	O	3,4,5-(OMe) ₃	6-F
X-92	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-F
X-93	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-F
X-94	O	—	7-F
X-95	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	7-F
X-96	O	—	8-F
X-97	O	—	5-Me
X-98	O	4-OMe	5-Me
X-99	O	4-OMe	6-Me
X-100	O	4-OMe	7-Me
X-101	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-Me
X-102	O	—	6-CF ₃
X-103	O	—	6-OMe
X-104	O	4-OMe	6-OMe
X-105	O	—	7-OMe
X-106	O	4-OMe	7-OMe
X-107	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
X-108	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
X-109	O	—	8-OMe
X-110	O	4-OMe	8-OMe
X-111	O	4-OMe	5,6-F ₂
X-112	O	4-OMe	5,7-F ₂
X-113	O	—	6,7-F ₂

Tabela 94

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
X-114	O	—	6,8-F ₂
X-115	O	4-OMe	5,7-Cl ₂
X-116	O	4-OMe	6-F, 7-OMe
X-117	O	3-F, 4-OMe	5-Cl
X-118	O	4-OMe	5,6,8-F ₃ , 7-OMe
X-119	O	—	7-CF ₃
X-120	O	4-F	7-OMe
X-121	O	4-OCHF ₂	7-OMe
X-122	O	4-Me	7-OMe

Tabela 95

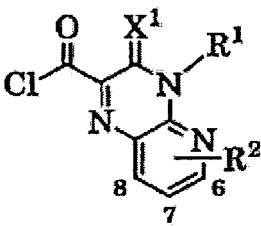
			
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XI-1	O	Me	—
XI-2	O	Et	—
XI-3	O	n-Pr	—
XI-4	O	i-Pr	—
XI-5	O	n-Bu	—
XI-6	O	s-Bu	—
XI-7	O	CH ₂ CH=CH ₂	—
XI-8	O	CH ₂ C≡CH	—
XI-9	O	CH ₂ CF ₃	—
XI-10	O	CH ₂ CH ₂ F	—
XI-11	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—
XI-12	O	CH ₂ SMe	—
XI-13	O	CH ₂ CH ₂ OMe	—
XI-14	O	CH(Me)CH ₂ OMe	—
XI-15	O	CH ₂ C(=O)OEt	—
XI-16	O	CH ₂ C(=O)Ot-Bu	—
XI-17	O	Bn	—
XI-18	O	(2-F)Bn	—
XI-19	O	(2-Cl)Bn	—
XI-20	O	(2-CF ₃)Bn	—
XI-21	O	(3-CF ₃)Bn	—
XI-22	O	(2-OMe)Bn	—
XI-23	O	CH(Me)Ph	—
XI-24	O		—

Tabela 96

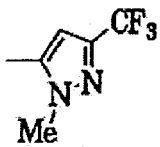
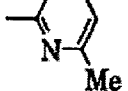
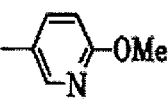
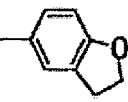
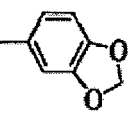
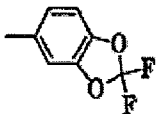
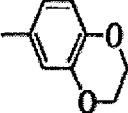
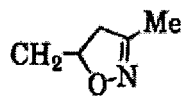
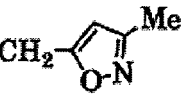
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XI-25	O		—
XI-26	O		—
XI-27	O		—
XI-28	O		—
XI-29	O		—
XI-30	O		—
XI-31	O		—
XI-32	O		—
XI-33	O		—
XI-34	O		—
XI-35	O	Me	6-Cl

Tabela 97

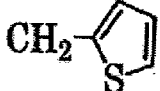
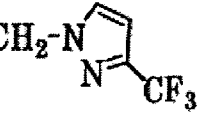
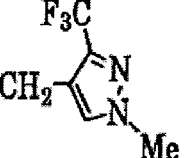
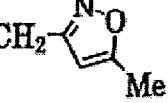
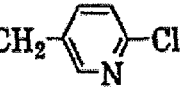
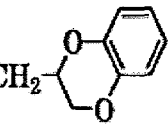
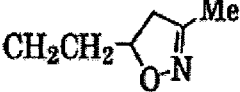
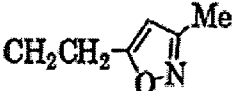
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XI-36	O	Me	6-OMe
XI-37	O	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	—
XI-38	O	CH ₂ CH ₂ CH=C(Me) ₂	—
XI-39	O	CH ₂ CH ₂ C≡CH	—
XI-40	O	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	—
XI-41	O	CH(Me)C(=O)Ot-Bu	—
XI-42	O	(2-OCHF ₂)Bn	—
XI-43	O	CH ₂ CH ₂ Ph	—
XI-44	O	CH ₂ - 	—
XI-45	O	CH ₂ -N 	—
XI-46	O	 CH ₂	—
XI-47	O	CH ₂ - 	—
XI-48	O	CH ₂ - 	—
XI-49	O	CH ₂ - 	—
XI-50	O	CH ₂ CH ₂ - 	—
XI-51	O	CH ₂ CH ₂ - 	—
XI-52	O	Bn	8-Me
XI-53	O	Bn	7-Me
XI-54	O	Bn	6-Me
XI-55	O	Bn	6-OMe

Tabela 98

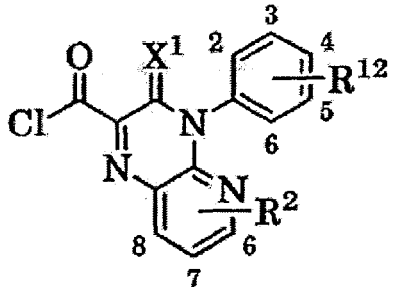
			
Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XII-1	O	—	—
XII-2	O	2-F	—
XII-3	O	3-F	—
XII-4	O	4-F	—
XII-5	O	2-Cl	—
XII-6	O	3-Cl	—
XII-7	O	4-Cl	—
XII-8	O	3-Br	—
XII-9	O	4-Br	—
XII-10	O	2-Me	—
XII-11	O	3-Me	—
XII-12	O	4-Me	—
XII-13	O	3-Et	—
XII-14	O	4-Et	—
XII-15	O	4-i-Pr	—
XII-16	O	4-c-Pr	—
XII-17	O	2-CF ₃	—
XII-18	O	3-CF ₃	—
XII-19	O	4-CF ₃	—
XII-20	O	2-OMe	—
XII-21	O	3-OMe	—
XII-22	O	4-OMe	—
XII-23	O	2-OCHF ₂	—
XII-24	O	3-OCHF ₂	—
XII-25	O	4-OCHF ₂	—

Tabela 99

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XII-26	O	2-OCF ₃	—
XII-27	O	3-OCF ₃	—
XII-28	O	4-OCF ₃	—
XII-29	O	4-SCF ₃	—
XII-30	O	3-CN	—
XII-31	O	2,3-F ₂	—
XII-32	O	2,4-F ₂	—
XII-33	O	2,5-F ₂	—
XII-34	O	2,6-F ₂	—
XII-35	O	3,4-F ₂	—
XII-36	O	3,5-F ₂	—
XII-37	O	2,3-Cl ₂	—
XII-38	O	2,4-Cl ₂	—
XII-39	O	2,5-Cl ₂	—
XII-40	O	2,6-Cl ₂	—
XII-41	O	3,4-Cl ₂	—
XII-42	O	3,5-Cl ₂	—
XII-43	O	2,3-(OMe) ₂	—
XII-44	O	3-OMe, 4-F	—
XII-45	O	3-OMe, 4-Me	—
XII-46	O	3,4-(OMe) ₂	—
XII-47	O	3-OMe, 5-F	—
XII-48	O	3,5-(OMe) ₂	—
XII-49	O	2-F, 4-OMe	—
XII-50	O	2,4-(OMe) ₂	—
XII-51	O	3-F, 4-OMe	—
XII-52	O	3-Cl, 4-OMe	—
XII-53	O	3-Me, 4-OMe	—
XII-54	O	2,5-(OMe) ₂	—
XII-55	O	3,4,5-(OMe) ₃	—

Tabela 100

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XII-56	O	—	6-F
XII-57	O	4-OMe	6-F
XII-58	O	—	6-Cl
XII-59	O	4-OMe	6-Cl
XII-60	O	4-OMe	6-OMe
XII-61	O	2-F, 5-CF ₃	—
XII-62	O	3-CF ₃ , 4-F	—
XII-63	O	2-F, 3-CF ₃	—
XII-64	O	3-F, 5-CF ₃	—
XII-65	O	2,5-(Me) ₂	—
XII-66	O	3,4-(Me) ₂	—
XII-67	O	3,5-(Me) ₂	—
XII-68	O	3,5-(CF ₃) ₂	—
XII-69	O	2,6-(OMe) ₂	—
XII-70	O	2-F, 3-Cl	—
XII-71	O	2-F, 4-Cl	—
XII-72	O	2-F, 5-Cl	—
XII-73	O	3-F, 4-Cl	—
XII-74	O	4-F, 2-Cl	—
XII-75	O	4-F, 3-Cl	—
XII-76	O	2-F, 3-Me	—
XII-77	O	2-F, 4-Me	—
XII-78	O	2-F, 5-Me	—
XII-79	O	3-F, 2-Me	—
XII-80	O	3-F, 4-Me	—

Tabela 101

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XII-81	O	3-F, 5-Me	—
XII-82	O	4-F, 2-Me	—
XII-83	O	4-F, 3-Me	—
XII-84	O	5-F, 2-Me	—
XII-85	O	2-F, 4-CF ₃	—
XII-86	O	3-F, 4-CF ₃	—
XII-87	O	4-F, 2-CF ₃	—
XII-88	O	3-F, 2-OMe	—
XII-89	O	4-F, 2-OMe	—
XII-90	O	5-F, 2-OMe	—
XII-91	O	2-F, 4-OCHF ₂	—
XII-92	O	3-F, 4-OCHF ₂	—
XII-93	O	4-F, 2-OCHF ₂	—
XII-94	O	4-F, 3-CN	—
XII-95	O	2-Cl, 4-Me	—
XII-96	O	3-Cl, 4-Me	—
XII-97	O	3-Cl, 4-OCHF ₂	—
XII-98	O	4-Me, 3-CF ₃	—
XII-99	O	4-Me, 2-OMe	—
XII-100	O	3-Me, 4-CN	—
XII-101	O	4-Me, 3-CN	—
XII-102	O	2,3,4-F ₃	—
XII-103	O	2,3,5-F ₃	—
XII-104	O	2,4,5-F ₃	—
XII-105	O	3,4,5-F ₃	—
XII-106	O	2,3-F ₂ , 4-Me	—
XII-107	O	2,6-F ₂ , 4-OMe	—

Tabela 102

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XII-108	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	—
XII-109	O	4-F, 2-Cl, 5-Me	—
XII-110	O	—	7-Cl
XII-111	O	—	6-Me
XII-112	O	—	7-Me
XII-113	O	—	8-Me
XII-114	O	3-Me	8-Me
XII-115	O	3-CF ₃	8-Me
XII-116	O	4-OMe	8-Me
XII-117	O	3-F, 4-Me	8-Me
XII-118	O	3-F, 4-OMe	8-Me
XII-119	O	—	8-OMe
XII-120	O	3-CF ₃	8-OMe
XII-121	O	3-F, 4-Me	8-Cl
XII-122	O	3-F, 4-Me	6-F
XII-123	O	3-F, 4-Me	6-Cl
XII-124	O	3-F, 4-Me	7-Me
XII-125	O	3-F, 4-Me	6-Me
XII-126	O	—	8-Cl
XII-127	O	3-F, 4-Me	6-OMe
XII-128	O	3-OEt	—
XII-129	O	4-OEt	—
XII-130	O	4-OMe	8-Cl
XII-131	O	—	6-SMe
XII-132	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-OMe
XII-133	O	3-F, 4-OEt	—
XII-134	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Cl

Tabela 103

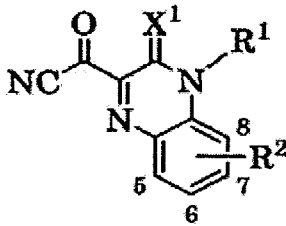
			
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XIII-1	O	Me	—
XIII-2	O	Et	—
XIII-3	O	n-Pr	—
XIII-4	O	i-Pr	—
XIII-5	O	c-Pr	—
XIII-6	O	n-Bu	—
XIII-7	O	t-Bu	—
XIII-8	O	c-Pen	—
XIII-9	O	n-Hex	—
XIII-10	O	CH ₂ CH=CH ₂	—
XIII-11	O	CH ₂ C≡CH	—
XIII-12	O	CH ₂ CF ₃	—
XIII-13	O	CH ₂ OMe	—
XIII-14	O	CH ₂ OEt	—
XIII-15	O	CH ₂ OPh	—
XIII-16	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	—
XIII-17	O	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	—
XIII-18	O	CH ₂ OCH ₂ - 	—
XIII-19	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—
XIII-20	O	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CN	—
XIII-21	O	CH ₂ OC(=O)t-Bu	—
XIII-22	O	CH ₂ SMe	—
XIII-23	O	CH ₂ SEt	—
XIII-24	O	CH ₂ SO ₂ Me	—
XIII-25	O	CH ₂ SO ₂ Et	—
XIII-26	O	CH ₂ CH ₂ OMe	—
XIII-27	O	CH(Me)CH ₂ OMe	—
XIII-28	O	CH ₂ CH ₂ SMe	—
XIII-29	O	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	—
XIII-30	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	—

Tabela 104

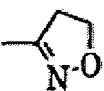
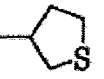
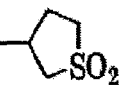
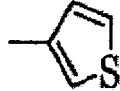
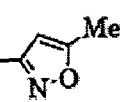
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XIII-31	O	CH ₂ C(=O)Me	—
XIII-32	O	CH ₂ C(=O)O-t-Bu	—
XIII-33	O	CH ₂ C(=O)NMe ₂	—
XIII-34	O	CH ₂ C(=O)-N 	—
XIII-35	O	CH ₂ CN	—
XIII-36	O	CH ₂ CH ₂ CN	—
XIII-37	O	Bn	—
XIII-38	O	(2-Cl)Bn	—
XIII-39	O	(3-Cl)Bn	—
XIII-40	O	(4-Cl)Bn	—
XIII-41	O	(2-OMe)Bn	—
XIII-42	O	(3-OMe)Bn	—
XIII-43	O	(4-OMe)Bn	—
XIII-44	O	(2,6-(OMe) ₂)Bn	—
XIII-45	O		—
XIII-46	O		—
XIII-47	O		—
XIII-48	O		—
XIII-49	O		—
XIII-50	O		—

Tabela 105

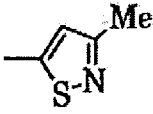
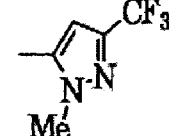
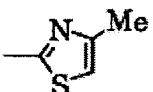
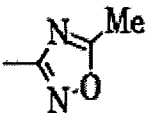
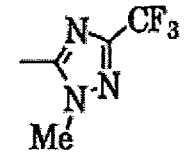
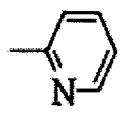
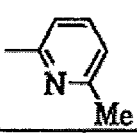
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XIII-51	O		—
XIII-52	O		—
XIII-53	O		—
XIII-54	O		—
XIII-55	O		—
XIII-56	O		—
XIII-57	O		—
XIII-58	O		—
XIII-59	O		—
XIII-60	O		—

Tabela 106

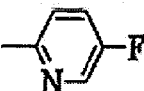
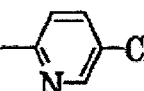
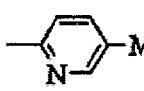
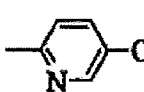
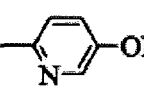
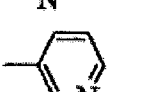
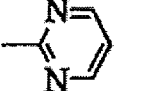
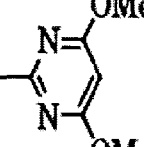
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XIII-61	O		—
XIII-62	O		—
XIII-63	O		—
XIII-64	O		—
XIII-65	O		—
XIII-66	O		—
XIII-67	O		—
XIII-68	O		—
XIII-69	O		—
XIII-70	O		—

Tabela 107

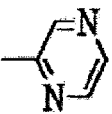
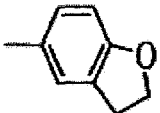
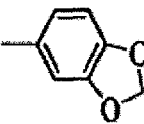
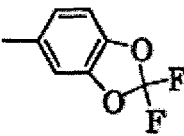
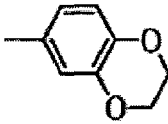
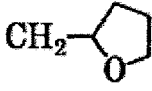
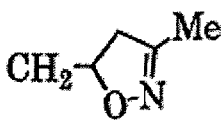
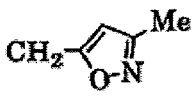
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XIII-71	O		—
XIII-72	O		—
XIII-73	O		—
XIII-74	O		—
XIII-75	O		—
XIII-76	O		—
XIII-77	O		—
XIII-78	O		—
XIII-79	O	NHMe	—
XIII-80	O	Me	6-F
XIII-81	O	Me	7-F
XIII-82	O	Me	5-Cl
XIII-83	O	Me	6-Cl
XIII-84	O	Me	7-Cl
XIII-85	O	Me	8-Cl

Tabela 108

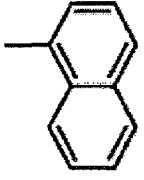
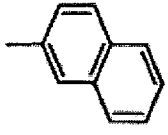
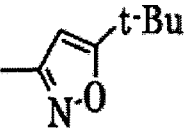
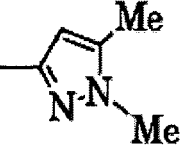
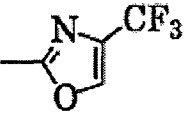
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XIII-86	O	CH ₂ CH ₂ OMe	8-Cl
XIII-87	O	Me	7-OMe
XIII-88	O	Me	5-SMe
XIII-89	O	Me	7-SMe
XIII-90	O	Me	5-SO ₂ Me
XIII-91	O	Me	7-SO ₂ Me
XIII-92	O	Me	6-NO ₂
XIII-93	O	Me	7-NO ₂
XIII-94	S	Me	—
XIII-95	O		—
XIII-96	O		—
XIII-97	O		—
XIII-98	O		—
XIII-99	O		—
XIII-100	O		—

Tabela 109

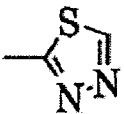
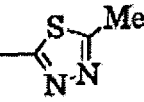
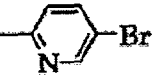
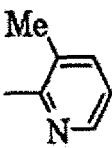
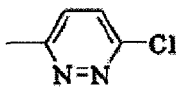
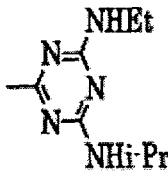
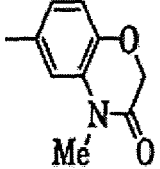
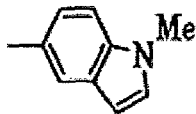
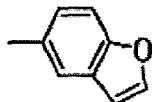
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XIII-101	O		—
XIII-102	O		—
XIII-103	O		—
XIII-104	O		—
XIII-105	O		—
XIII-106	O		—
XIII-107	O		—
XIII-108	O		—
XIII-109	O		—
XIII-110	O	N(Me)C(=O)Ot-Bu	—

Tabela 110

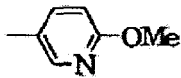
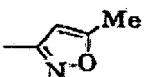
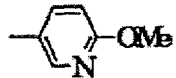
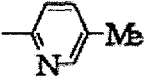
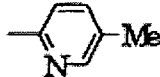
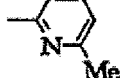
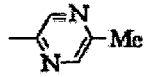
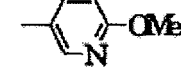
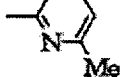
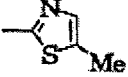
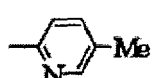
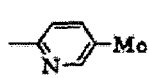
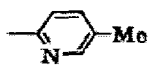
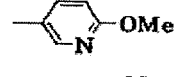
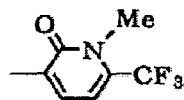
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XIII-111	O		5-F
XIII-112	O	Bn	6-F
XIII-113	O		6-F
XIII-114	O	Me	5-CH ₂ OMe
XIII-115	O		5,7-F ₂
XIII-116	O		7-Cl
XIII-117	O	Et	5-Cl
XIII-118	O	n-Bu	5-Cl
XIII-119	O		7-Me
XIII-120	O		6-CF ₃
XIII-121	O		—
XIII-122	O		5-Cl
XIII-123	O		6-F
XIII-124	O		—
XIII-125	O		5-F
XIII-126	O		5-Cl
XIII-127	O		5-Me
XIII-128	O		5-Me
XIII-129	O		—

Tabela 111

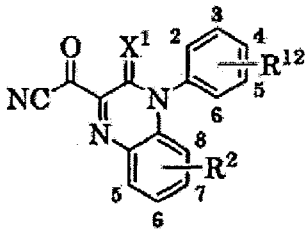
			
Composto No.	X¹	R¹²	R²
XIV-1	O	—	—
XIV-2	O	2-F	—
XIV-3	O	3-F	—
XIV-4	O	4-F	—
XIV-5	O	2-Cl	—
XIV-6	O	3-Cl	—
XIV-7	O	4-Cl	—
XIV-8	O	3-Me	—
XIV-9	O	4-Me	—
XIV-10	O	3-Et	—
XIV-11	O	4-Et	—
XIV-12	O	3-i-Pr	—
XIV-13	O	4-c-Pr	—
XIV-14	O	3-CF₃	—
XIV-15	O	4-CF₃	—
XIV-16	O	4-OH	—
XIV-17	O	2-OMe	—
XIV-18	O	3-OMe	—
XIV-19	O	4-OMe	—
XIV-20	O	3-OEt	—
XIV-21	O	4-OEt	—
XIV-22	O	3-O-n-Pr	—
XIV-23	O	3-O-i-Pr	—
XIV-24	O	4-O-i-Pr	—
XIV-25	O	4-OCH₂CH=CH₂	—
XIV-26	O	4-OCH₂C≡CH	—

Tabela 112

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-27	O	3-OCHF ₂	—
XIV-28	O	4-OCHF ₂	—
XIV-29	O	3-OCF ₃	—
XIV-30	O	4-CH ₂ 	—
XIV-31	O	3-SMe	—
XIV-32	O	4-SMe	—
XIV-33	O	3-SO ₂ Me	—
XIV-34	O	4-SO ₂ Me	—
XIV-35	O	2-NO ₂	—
XIV-36	O	3-NO ₂	—
XIV-37	O	4-NO ₂	—
XIV-38	O	3-CN	—
XIV-39	O	4-CN	—
XIV-40	O	4-C(=O)Me	—
XIV-41	O	4-C(=O)OMe	—
XIV-42	O	4-CH ₂ OMe	—
XIV-43	O	3-OMe, 4-Cl	—
XIV-44	O	3-OMe, 4-Me	—
XIV-45	O	3,4-(OMe) ₂	—
XIV-46	O	3,5-(OMe) ₂	—
XIV-47	O	2-F, 4-OMe	—
XIV-48	O	2-Cl, 4-OMe	—
XIV-49	O	2,4-(OMe) ₂	—
XIV-50	O	3-F, 4-OMe	—
XIV-51	O	3-Cl, 4-OMe	—
XIV-52	O	3-Me, 4-OMe	—
XIV-53	O	3,4,5-(OMe) ₃	—
XIV-54	O	4-OMe	5-F
XIV-55	O	4-OMe	6-F
XIV-56	O	4-OMe	7-F

Tabela 113

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-57	O	4-OMe	8-F
XIV-58	O	—	5-Cl
XIV-59	O	—	8-Cl
XIV-60	O	4-OMe	5-Cl
XIV-61	O	4-OMe	6-Cl
XIV-62	O	4-OMe	7-Cl
XIV-63	O	4-OMe	8-Cl
XIV-64	O	4-OCH ₂ CN	—
XIV-65	O	4-OCH ₂ -c-Pr	—
XIV-66	O	4-OCH ₂ CF ₃	—
XIV-67	O	4-NMe ₂	—
XIV-68	O	3,4-Me ₂	—
XIV-69	O	2-F, 4-Me	—
XIV-70	O	3-F, 4-Me	—
XIV-71	O	3-Me, 4-F	—
XIV-72	O	2-Cl, 4-Me	—
XIV-73	O	3-Cl, 4-Me	—
XIV-74	O	3-OEt, 4-OMe	—
XIV-75	O	2,3,4-(OMe) ₃	—
XIV-76	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	—
XIV-77	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	—
XIV-78	O	3,5-Cl ₂ , 4-OMe	—
XIV-79	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	—
XIV-80	O	3,4-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-	—
XIV-81	O	3,4-(CH ₂ OCH ₂)-	—
XIV-82	O	3,4-(OCH ₂ O)-	7-F
XIV-83	O	2,3-(OCH ₂ CH ₂ O)-	—
XIV-84	O	3,4-(OCH ₂ CH(Me)O)-	—
XIV-85	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ CH ₂ O)-	—

Tabela 114

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-86	O	—	5-F
XIV-87	O	3,4,5-(OMe) ₃	5-F
XIV-88	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	5-F
XIV-89	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	5-F
XIV-90	O	—	6-F
XIV-91	O	3,4,5-(OMe) ₃	6-F
XIV-92	O	3,4-(OCH ₂ O)-	6-F
XIV-93	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-F
XIV-94	O	—	7-F
XIV-95	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	7-F
XIV-96	O	—	8-F
XIV-97	O	—	5-Me
XIV-98	O	4-OMe	5-Me
XIV-99	O	4-OMe	6-Me
XIV-100	O	4-OMe	7-Me
XIV-101	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-Me
XIV-102	O	—	6-CF ₃
XIV-103	O	—	6-OMe
XIV-104	O	4-OMe	6-OMe
XIV-105	O	—	7-OMe
XIV-106	O	4-OMe	7-OMe
XIV-107	O	2,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
XIV-108	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	7-OMe
XIV-109	O	—	8-OMe
XIV-110	O	4-OMe	8-OMe
XIV-111	O	4-OMe	5,6-F ₂
XIV-112	O	4-OMe	5,7-F ₂
XIV-113	O	—	6,7-F ₂

Tabela 115

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XIV-114	O	—	6,8-F ₂
XIV-115	O	4-OMe	5,7-Cl ₂
XIV-116	O	4-OMe	6-F, 7-OMe
XIV-117	O	3-F, 4-OMe	5-Cl
XIV-118	O	4-OMe	5,6,8-F ₃ , 7-OMe
XIV-119	O	—	7-CF ₃
XIV-120	O	4-F	7-OMe
XIV-121	O	4-OCHF ₂	7-OMe
XIV-122	O	4-Me	7-OMe
XIV-123	O	4-OMe	5-Br
XIV-124	O	4-F	5-F
XIV-125	O	3-F, 4-OEt	—

Tabela 116

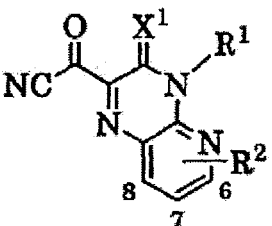
			
Composto No.	X¹	R¹	R²
XV-1	O	Me	—
XV-2	O	Et	—
XV-3	O	n-Pr	—
XV-4	O	i-Pr	—
XV-5	O	n-Bu	—
XV-6	O	s-Bu	—
XV-7	O	CH₂CH=CH₂	—
XV-8	O	CH₂C≡CH	—
XV-9	O	CH₂CF₃	—
XV-10	O	CH₂CH₂F	—
XV-11	O	CH₂OCH₂CF₃	—
XV-12	O	CH₂SMe	—
XV-13	O	CH₂CH₂OMe	—
XV-14	O	CH(Me)CH₂OMe	—
XV-15	O	CH₂C(=O)OEt	—
XV-16	O	CH₂C(=O)Ot-Bu	—
XV-17	O	Bn	—
XV-18	O	(2-F)Bn	—
XV-19	O	(2-Cl)Bn	—
XV-20	O	(2-CF₃)Bn	—
XV-21	O	(3-CF₃)Bn	—
XV-22	O	(2-OMe)Bn	—
XV-23	O	CH(Me)Ph	—
XV-24	O		—

Tabela 117

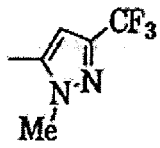
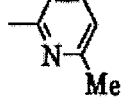
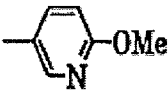
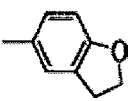
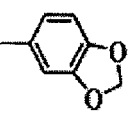
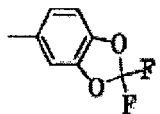
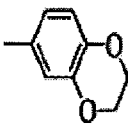
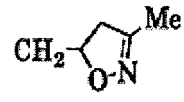
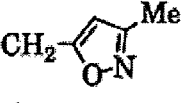
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XV-25	O		—
XV-26	O		—
XV-27	O		—
XV-28	O		—
XV-29	O		—
XV-30	O		—
XV-31	O		—
XV-32	O		—
XV-33	O		—
XV-34	O		—
XV-35	O	Me	6-Cl

Tabela 118

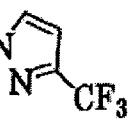
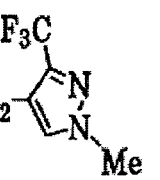
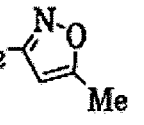
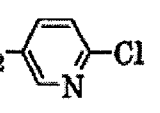
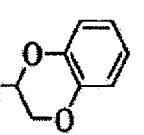
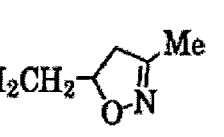
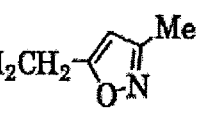
Composto No.	X ¹	R ¹	R ²
XV-36	O	Me	6-OMe
XV-37	O	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	—
XV-38	O	CH ₂ CH ₂ CH=C(Me) ₂	—
XV-39	O	CH ₂ CH ₂ C≡CH	—
XV-40	O	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	—
XV-41	O	CH(Me)C(=O)Ot-Bu	—
XV-42	O	(2-OCHF ₂)Bn	—
XV-43	O	CH ₂ CH ₂ Pb	—
XV-44	O	CH ₂ - 	—
XV-45	O	CH ₂ -N 	—
XV-46	O	CH ₂ - 	—
XV-47	O	CH ₂ - 	—
XV-48	O	CH ₂ - 	—
XV-49	O	CH ₂ - 	—
XV-50	O	CH ₂ CH ₂ - 	—
XV-51	O	CH ₂ CH ₂ - 	—
XV-52	O	Bn	8-Me
XV-53	O	Bn	7-Me
XV-54	O	Bn	6-Me
XV-55	O	Bn	6-OMe

Tabela 119

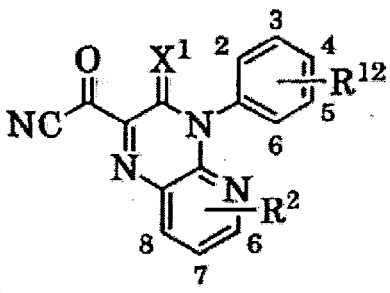
			
Composto No.	X¹	R¹²	R²
XVI-1	O	—	—
XVI-2	O	2-F	—
XVI-3	O	3-F	—
XVI-4	O	4-F	—
XVI-5	O	2-Cl	—
XVI-6	O	3-Cl	—
XVI-7	O	4-Cl	—
XVI-8	O	3-Br	—
XVI-9	O	4-Br	—
XVI-10	O	2-Me	—
XVI-11	O	3-Me	—
XVI-12	O	4-Me	—
XVI-13	O	3-Et	—
XVI-14	O	4-Et	—
XVI-15	O	4-i-Pr	—
XVI-16	O	4-c-Pr	—
XVI-17	O	2-CF₃	—
XVI-18	O	3-CF₃	—
XVI-19	O	4-CF₃	—
XVI-20	O	2-OMe	—
XVI-21	O	3-OMe	—
XVI-22	O	4-OMe	—
XVI-23	O	2-OCHF₂	—
XVI-24	O	3-OCHF₂	—
XVI-25	O	4-OCHF₂	—

Tabela 120

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-26	O	2-OCF ₃	—
XVI-27	O	3-OCF ₃	—
XVI-28	O	4-OCF ₃	—
XVI-29	O	4-SCF ₃	—
XVI-30	O	3-CN	—
XVI-31	O	2,3-F ₂	—
XVI-32	O	2,4-F ₂	—
XVI-33	O	2,5-F ₂	—
XVI-34	O	2,6-F ₂	—
XVI-35	O	3,4-F ₂	—
XVI-36	O	3,5-F ₂	—
XVI-37	O	2,3-Cl ₂	—
XVI-38	O	2,4-Cl ₂	—
XVI-39	O	2,5-Cl ₂	—
XVI-40	O	2,6-Cl ₂	—
XVI-41	O	3,4-Cl ₂	—
XVI-42	O	3,5-Cl ₂	—
XVI-43	O	2,3-(OMe) ₂	—
XVI-44	O	3-OMe, 4-F	—
XVI-45	O	3-OMe, 4-Me	—
XVI-46	O	3,4-(OMe) ₂	—
XVI-47	O	3-OMe, 5-F	—
XVI-48	O	3,5-(OMe) ₂	—
XVI-49	O	2-F, 4-OMe	—
XVI-50	O	2,4-(OMe) ₂	—
XVI-51	O	3-F, 4-OMe	—
XVI-52	O	3-Cl, 4-OMe	—
XVI-53	O	3-Me, 4-OMe	—
XVI-54	O	2,5-(OMe) ₂	—
XVI-55	O	3,4,5-(OMe) ₃	—

Tabela 121

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-56	O	—	6-F
XVI-57	O	4-OMe	6-F
XVI-58	O	—	6-Cl
XVI-59	O	4-OMe	6-Cl
XVI-60	O	4-OMe	6-OMe
XVI-61	O	2-F, 5-CF ₃	—
XVI-62	O	3-CF ₃ , 4-F	—
XVI-63	O	2-F, 3-CF ₃	—
XVI-64	O	3-F, 5-CF ₃	—
XVI-65	O	2,5-(Me) ₂	—
XVI-66	O	3,4-(Me) ₂	—
XVI-67	O	3,5-(Me) ₂	—
XVI-68	O	3,5-(CF ₃) ₂	—
XVI-69	O	2,6-(OMe) ₂	—
XVI-70	O	2-F, 3-Cl	—
XVI-71	O	2-F, 4-Cl	—
XVI-72	O	2-F, 5-Cl	—
XVI-73	O	3-F, 4-Cl	—
XVI-74	O	4-F, 2-Cl	—
XVI-75	O	4-F, 3-Cl	—
XVI-76	O	2-F, 3-Me	—
XVI-77	O	2-F, 4-Me	—
XVI-78	O	2-F, 5-Me	—
XVI-79	O	3-F, 2-Me	—
XVI-80	O	3-F, 4-Me	—

Tabela 122

Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-81	O	3-F, 5-Me	—
XVI-82	O	4-F, 2-Me	—
XVI-83	O	4-F, 3-Me	—
XVI-84	O	5-F, 2-Me	—
XVI-85	O	2-F, 4-CF ₃	—
XVI-86	O	3-F, 4-CF ₃	—
XVI-87	O	4-F, 2-CF ₃	—
XVI-88	O	3-F, 2-OMe	—
XVI-89	O	4-F, 2-OMe	—
XVI-90	O	5-F, 2-OMe	—
XVI-91	O	2-F, 4-OCHF ₂	—
XVI-92	O	3-F, 4-OCHF ₂	—
XVI-93	O	4-F, 2-OCHF ₂	—
XVI-94	O	4-F, 3-CN	—
XVI-95	O	2-Cl, 4-Me	—
XVI-96	O	3-Cl, 4-Me	—
XVI-97	O	3-Cl, 4-OCHF ₂	—
XVI-98	O	4-Me, 3-CF ₃	—
XVI-99	O	4-Me, 2-OMe	—
XVI-100	O	3-Me, 4-CN	—
XVI-101	O	4-Me, 3-CN	—
XVI-102	O	2,3,4-F ₃	—
XVI-103	O	2,3,5-F ₃	—
XVI-104	O	2,4,5-F ₃	—
XVI-105	O	3,4,5-F ₃	—
XVI-106	O	2,3-F ₂ , 4-Me	—
XVI-107	O	2,6-F ₂ , 4-OMe	—

Tabela 123

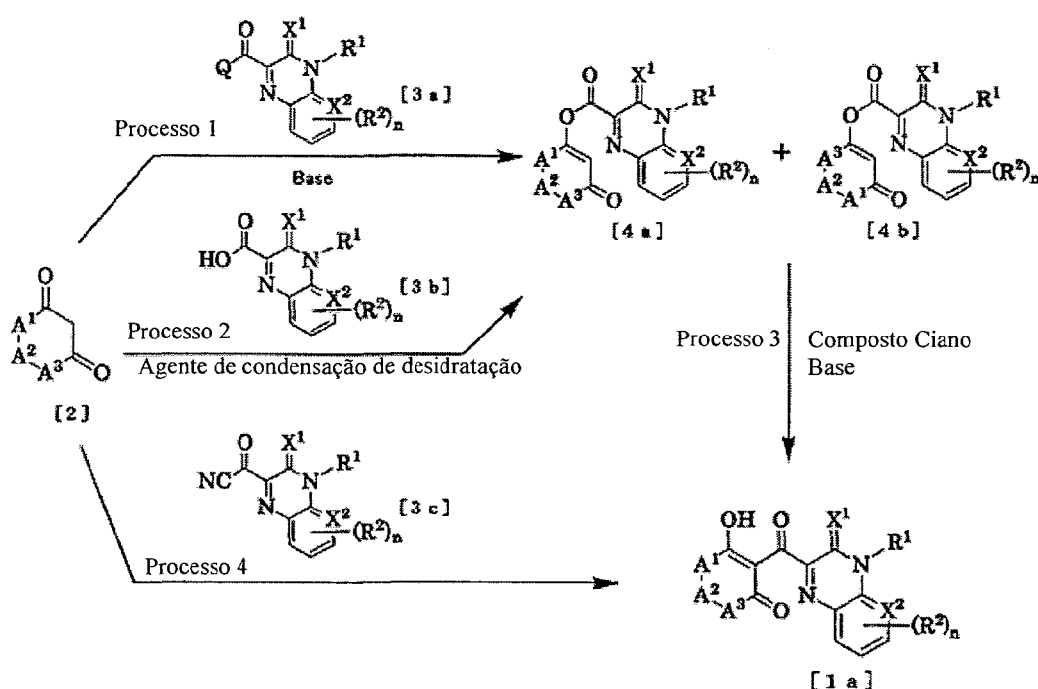
Composto No.	X ¹	R ¹²	R ²
XVI-108	O	3,5-F ₂ , 4-OMe	—
XVI-109	O	4-F, 2-Cl, 5-Me	—
XVI-110	O	—	7-Cl
XVI-111	O	—	6-Me
XVI-112	O	—	7-Me
XVI-113	O	—	8-Me
XVI-114	O	3-Me	8-Me
XVI-115	O	3-CF ₃	8-Me
XVI-116	O	4-OMe	8-Me
XVI-117	O	3-F, 4-Me	8-Me
XVI-118	O	3-F, 4-OMe	8-Me
XVI-119	O	—	8-OMe
XVI-120	O	3-CF ₃	8-OMe
XVI-121	O	3-F, 4-Me	8-Cl
XVI-122	O	3-F, 4-Me	6-F
XVI-123	O	3-F, 4-Me	6-Cl
XVI-124	O	3-F, 4-Me	7-Me
XVI-125	O	3-F, 4-Me	6-Me
XVI-126	O	—	8-Cl
XVI-127	O	3-F, 4-Me	6-OMe
XVI-128	O	3-OEt	—
XVI-129	O	4-OEt	—
XVI-130	O	4-OMe	8-Cl
XVI-131	O	—	6-SMe
XVI-132	O	3,4-(OCH ₂ CH ₂ O)-	6-OMe
XVI-133	O	3-F, 4-OEt	—
XVI-134	O	3,4-(OCH ₂ O)-	8-Cl

Métodos representativos para produzir o composto da presente invenção representado pela fórmula [I] será ilustrado a seguir, mas o método não é limitado a estes métodos.

<Método de produção 1>

5 O composto da presente invenção representado pela seguinte fórmula [1a] pode ser produzido pelos métodos com base no esquema de reação ilustrado no seguinte.

[Fórmula química 12]



em que R¹, R², A¹, A², A³, n, X¹ e X² respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; e Q representa um grupo abandonador, tais como halogênio, um grupo alquilcarbonilóxi, um grupo alcóxicarbonilóxi, um grupo haloalquilcarbonilóxi, um grupo haloalcóxicarbonilóxi, um grupo benzóilóxi, um grupo piridila ou um grupo imidazolila.

(Processo 1)

15 Compostos de éster de enol representados pela fórmulas [4a] e [4b] podem ser produzidos permitindo que um composto representado pela fórmula [2] reaja com um composto representado pela fórmula [3a] em um

solvente na presença de uma base.

(Daqui em diante, por exemplo, o “composto representado pela fórmula [2]” também pode ser simplesmente descrito como “fórmula [2].”)

5 A quantidade de uso da fórmula [3a] da forma aqui usada pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,5 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em 1 mol da fórmula [2].

10 Como a base que pode ser usada no presente processo, por exemplo, aminas orgânicas, tais como trietilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina, N,N-dimetilanilina e 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno; sais de metal de ácido carboxílico representados por carbonatos de metal, tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio, carbonato de magnésio e carbonato de cálcio; hidrogenocarbonatos de metal, tais como hidrogenocarbonato de sódio e hidrogenocarbonato de potássio; e acetatos de
15 metal, tais como acetato de sódio, acetato de potássio, acetato de cálcio e acetato de magnésio; alcóxidos de metal, tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio, butóxido terciário de sódio, metóxido de potássio e butóxido terciário de potássio; hidróxidos de metal, tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e hidróxido de magnésio; hidretos
20 de metal, tais como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio; e similares podem ser incluídos.

 A quantidade de uso da base pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,5 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol da fórmula [2].

25 O solvente que pode ser usado no presente processo pode ser qualquer solvente desde que ele não iniba o progresso da presente reação, e por exemplo, nitrilas, tal como acetonitrila; éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, tetraidrofurano, dioxano, monoglima e diglima; hidrocarbonetos halogenados, tais como dicloroetano, clorofórmio,

tetraclorocarbono e tetracloroetano; hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, clorobenzeno, nitrobenzeno e tolueno; amidas, tais como N,N-dimetilformamida e N,N-dimetilacetamida; imidazolinonas, tal como 1,3-dimetil-2-imidazolinona; compostos de enxofre, tal como sulfóxido de dimetila; e similares podem ser usados. Adicionalmente, misturas de solventes destes também podem ser usadas.

A quantidade de uso do solvente é 0,01 a 100 L, e preferivelmente 0,1 a 10 L, com base na fórmula [2].

A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -20 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C.

Além disso, a reação pode ser realizada usando um catalisador de transferência de fases, tal como um sal de amônio quaternário. No caso de usar um catalisador de transferência de fases, a quantidade de uso deste é 0,0001 a 1,0 mol, e preferivelmente 0,001 a 0,1 mols, com base em um mol da fórmula [2].

O tempo de reação pode variar dependendoda temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 48 horas.

Os compostos da fórmula [4a] e fórmula [4b], que são os produtos alvo da reação, podem ser coletados do sistema de reação por um método convencional depois de finalizar a reação, e então podem ser purificados por operações, tais como cromatografia em coluna e recristalização, conforme necessário.

(Processo 2)

As fórmulas [4a] e [4b] também podem ser produzidas permitindo que a fórmula [2] e a fórmula [3b] reajam em um solvente na presença de um agente de condensação de desidratação na presença ou ausência de uma base.

A quantidade de uso da fórmula [3b] da forma usada no presente processo pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,5 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol da fórmula [2].

5 Como o agente de condensação de desidratação, dicicloexilcarbodiimida (DCC), N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (EDC ou WSC), N,N-carbonildiimidazol, cloreto de 2-cloro-1,3-dimetilimidazólio, iodeto de 2-cloro-1-piridínio e similares podem ser usados.

A base e o solvente que podem ser usados no presente processo podem ser exemplificados pelos descritos no processo 1.

10 A quantidade da base usada na reação do presente processo é 0 a 100 mols, e preferivelmente 0 a 10 mols, com base em um mol da fórmula [2].

A quantidade de uso do solvente é 0,01 a 100 L, e preferivelmente 0,1 a 10 L, com base em um mol da fórmula [2].

15 A temperatura de reação pode ser apropriadamente selecionada na faixa de -20 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C.

O tempo de reação pode variar dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é
20 normalmente de 10 minutos a 48 horas.

(Processo 3)

O fórmula [1a] pode ser produzida reagindo a fórmula [4a] e a fórmula [4b] produzida no processo 2 ou 3, com um composto ciano na presença de uma base.

25 A base que pode ser usada no presente processo pode ser exemplificado pelas mesmas bases descritas com relação ao processo 1.

A quantidade de uso da base pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,5 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol da fórmula [4a] e fórmula [4b].

O composto ciano que pode ser usado no presente processo pode ser exemplificado por cianeto de potássio, cianeto de sódio, cianoidrina de acetona, cianeto de hidrogênio, um polímero que carrega cianeto de hidrogênio, e similares.

5 A quantidade de uso do composto ciano pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,01 a 1,0 mol, e preferivelmente 0,05 a 0,2 mol, com base em um mol das fórmulas [4a] e [4b].

Além disso, no presente processo, um catalisador de transferência de fases, tal como éter coroa também pode ser usado.

10 A quantidade de uso do catalisador de transferência de fases é 0,001 a 10 mols, e preferivelmente 0,01 a 1,0 mol, com base em um mol das fórmulas [4a] e [4b].

O solvente que pode ser usado na presente reação pode ser exemplificado pelos mesmos solventes descritos com relação ao processo 1, e
15 a quantidade de uso deste é 0,01 a 100 L, e preferivelmente 0,1 a 10 L, com base em um mol das fórmulas [4a] e [4b].

A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -20 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C.

20 O tempo de reação pode variar dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 48 horas.

Adicionalmente, no presente processo, a fórmula [1a] ainda pode ser produzida, mesmo se as fórmulas [4a] e [4b] produzidas no processo
25 1 ou processo 2 forem usadas sem ser isoladas.

(Processo 4)

O composto da fórmula [1a] também pode ser produzido reagindo a fórmula [2] com a fórmula [3c] na presença de uma base ou um ácido de Lewis. Além do mais, o intermediário de produção da fórmula [3c]

pode ser produzido reagindo um composto representado pela fórmula [3a-1] com um agente de cianogeração. A quantidade de uso da fórmula [3c] usada no presente processo pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,5 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol da fórmula [2].

O ácido de Lewis que pode ser usado inclui cloreto de zinco, cloreto de alumínio e similares.

No caso de usando um ácido de Lewis, a quantidade de uso do ácido de Lewis pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,01 a 100 mols, e preferivelmente 0,1 a 10 mols, com base em um mol da fórmula [2].

A base que pode ser usada no presente processo pode ser exemplificada pelas mesmas bases descritas com relação ao processo 1.

No caso de usar uma base, a quantidade de uso da base pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,5 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol da fórmula [2].

O solvente que pode ser usado no presente processo pode ser exemplificado pelos mesmos solventes descritos com relação ao processo 1, e a quantidade de uso deste é 0,01 a 100 L, e preferivelmente 0,1 a 10 L, com base em um mol da fórmula [2].

A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -20 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C.

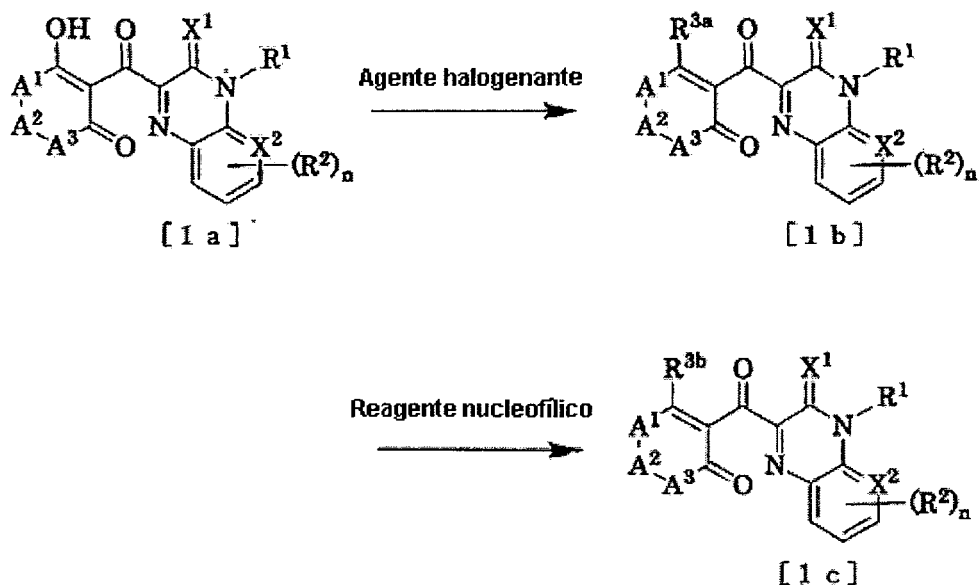
O tempo de reação pode variar dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 48 horas.

<Método de produção 2>

Além disso, compostos representado pela fórmula [1b] e [1c] da presente invenção podem ser produzidos do composto representado pela fórmula [1a] da presente invenção de acordo com o seguinte método de

produção.

[Fórmula química 13]



em que X^1 , X^2 , R^1 , R^2 , A^1 , A^2 , A^3 e n respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; R^{3a} representa um átomo de halogênio, tais como cloro ou bromo; e R^{3b} representa um grupo amino, um grupo alquiltio C_1-C_6 , um grupo alquil C_1-C_6 haloalquiltio C_1-C_6 , um grupo alqueniltio C_2-C_6 , um grupo alquiniltio C_2-C_6 , um grupo alquilcarbonilóxi C_1-C_6 , um grupo alquenilcarbonilóxi C_2-C_6 , um grupo alquinilcarbonilóxi C_2-C_6 , um grupo fenóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), um grupo feniltio (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), um grupo fenilcarbonilóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes), um grupo 1,2,4-triazol-1-ila, um grupo 1,2,3-triazol-1-ila, um grupo 1,2,3-triazol-2-ila, um grupo imidazol-1-ila, um grupo pirazol-1-ila, um grupo tetrazol-1-ila, ou um grupo tetrazol-2-ila.

Em outras palavras, o composto da fórmula [1b] pode ser produzido reagindo o composto da fórmula [1a] com um agente de halogenação, e o composto da fórmula [1c] pode ser produzido reagindo o composto da fórmula [1b] com um reagente nucleofílico na presença de uma base.

O agente de halogenação que pode ser usado no processo de conversão da fórmula [1a] à fórmula [1b], inclui cloreto de tionila, brometo de tionila, oxícloreto de fósforo, oxibrometo de fósforo, tribrometo de feniltrimetilamônio, um brometo do ácido de Meldrums e similares. A
5 quantidade de uso do agente de halogenação pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,5 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol do composto da fórmula [1a].

O solvente que pode ser usado pode ser exemplificado pelos mesmos solventes descritos com relação ao processo 1 do método de
10 produção 1.

A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -20 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C. O tempo de reação pode variar dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da
15 reação, e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 48 horas.

Como o reagente nucleofílico que pode ser usado no processo de conversão da fórmula [1b] à fórmula [1c], alcoóis, tais como metanol, etanol e álcool benzílico; mercaptanos, tais como metil mercaptano e etil mercaptano; aminas, tais como amônia, metilamina e etilamina; e similares
20 podem ser incluídos. A quantidade de uso do reagente nucleofílico pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,5 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol do composto da fórmula [1a].

A base que pode ser usada pode ser exemplificado pelas mesmas bases descritas com relação ao processo 1 do método de produção 1,
25 e o solvente que pode ser usado pode ser exemplificado pelos mesmos solventes descritos com relação ao processo 1 do método de produção 1.

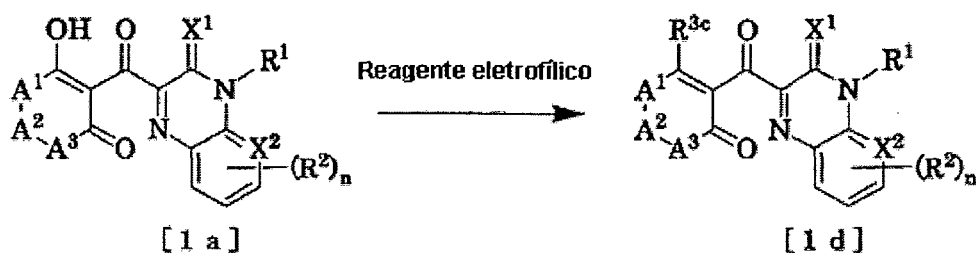
A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -20 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C. O tempo de reação pode variar

dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação, e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 48 horas.

<Método de produção 3>

O composto da presente invenção representado pela seguinte fórmula [1d] pode ser produzido por um método mostrado no esquema de reação ilustrado a seguir.

[Fórmula química 14]



em que X^1 , X^2 , R^1 , R^2 , A^1 , A^2 , A^3 e n respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; e R^{3c} representa um grupo alcóxi C_1 - C_6 , um grupo alquilsulfonilóxi C_1 - C_6 , um grupo alquilcarbonilóxi C_1 - C_6 , um grupo alquenilcarbonilóxi C_2 - C_6 , um grupo alquinilcarbonilóxi C_2 - C_6 , um grupo fenilsulfonilóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes) ou um grupo fenilcarbonilóxi (o grupo pode ser substituído por um ou dois ou mais R^{14} idênticos ou diferentes).

Em outras palavras, o composto da fórmula [1d] pode ser produzido reagindo o composto da fórmula [1a] com um reagente eletrofílico em um solvente na presença/ausência de uma base.

Como o reagente eletrofílico que pode ser usado, haletos, tais como iodometano e brometo de benzila; cloretos ácidos, tais como cloreto de acetila e cloreto de benzoila; cloretos de ácido sulfônico, tais como cloreto de metanossulfonila e cloreto de p-toluenossulfonila; ésteres de ácido sulfúrico, tais como ácido dimetil sulfúrico e ácido dietil sulfúrico; e similares podem ser incluídos, por exemplo. A quantidade de uso do reagente eletrofílico pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,1 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol do composto da fórmula [1a].

A base que pode ser usada pode ser exemplificado pelas mesmas bases descritas com relação ao processo 1 do método de produção 1, e a quantidade de uso da base pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol do composto da fórmula [1a].

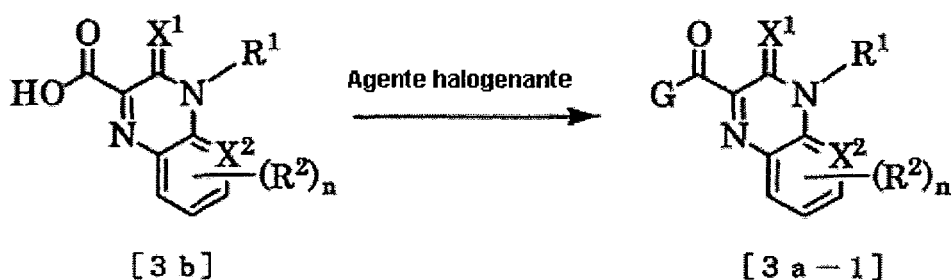
O solvente que pode ser usado pode ser exemplificado pelos mesmos solventes descritos com relação ao processo 1 do método de produção 1.

A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -20 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C. O tempo de reação pode variar dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação, e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 48 horas.

O método para produzir um intermediário de produção para o composto da presente invenção será descrito.

<Método de produção de intermediário 1>

[Fórmula química 15]



em que R¹, R², n, X¹ e X² respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; e G representa um átomo de halogênio, tais como cloro ou bromo.

A fórmula [3a-1] que é um intermediário de produção para o composto da presente invenção, pode ser produzida reagindo a fórmula [3b] com um agente de halogenação apropriado em um solvente ou sem solvente.

Como o agente de halogenação que pode ser usado no presente processo, cloreto de oxalila, cloreto de tionila e similares podem ser incluídos,

por exemplo.

A quantidade de uso do agente de halogenação pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,01 a 100 mols, e preferivelmente 0,1 a 10 mols, com base em um mol da fórmula [3b].

5 Exemplos do solvente incluem hidrocarbonetos halogenados, tais como diclorometano e clorofórmio; éteres, tais como éter dietílico e tetraidrofurano; e hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno e tolueno.

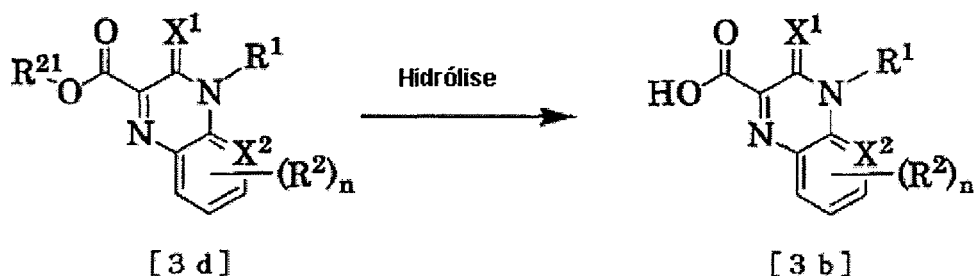
A quantidade de uso do solvente é 0 a 100 L, e preferivelmente 0,01 a 10 L, com base em um mol da fórmula [3b].

10 A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -100 °C a 200 °C, e é preferivelmente selecionada de 0 °C a 100 °C.

O tempo de reação pode variar com a temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 24 horas.

15 <Método de produção de intermediário 2>

[Fórmula química 16]



em que R¹, R², n, X¹ e X² respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; e R²¹ representa um grupo alquila inferior, um grupo benzila que pode ser substituído, ou um grupo fenila que pode ser substituído.

20 O intermediário de produção da fórmula [3b] pode ser produzido hidrolisando a fórmula [3d] em água ou uma mistura de solventes, na presença de um ácido ou na presença de uma base.

Como a base que pode ser usada no presente processo, bases inorgânicas, tais como carbonato de potássio, hidreto de sódio e hidróxido de

sódio; e bases orgânicas, tais como 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno podem ser incluídos, por exemplo.

A quantidade de uso da base pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,01 a 100 mols, e preferivelmente 0,1 a 10 mols, com base em um mol do composto [3d].

Como o ácido que pode ser usado no presente processo, ácidos inorgânicos, tais como ácido clorídrico, ácido bromídrico e ácido sulfúrico; e ácidos orgânicos, tais como ácido acético e ácido trifluoracético podem ser incluídos, por exemplo.

A quantidade de uso do ácido pode ser de 1 mol a um grande excesso, e preferivelmente 1 a 100 mols, com base em um mol do composto da fórmula [3d].

A mistura de solventes que pode ser usada no presente processo é uma mistura de solventes de água e um solvente orgânico, e exemplos dos solventes orgânicos incluem alcoóis, tais como metanol e etanol; éteres, tal como tetraidrofurano; cetonas, tais como acetona e metil isobutil cetona; amidas, tais como N,N-dimetilformamida e N,N-dimetilacetamida; compostos de enxofre, tais como sulfóxido de dimetila e sulfolano; acetonitrila; e misturas destes.

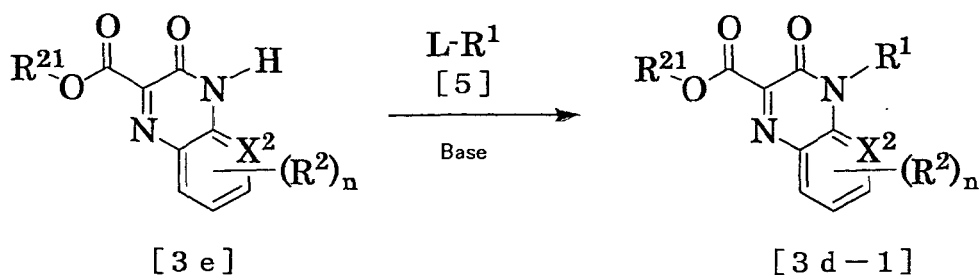
A quantidade de uso do solvente é 0,01 a 100 L, e preferivelmente 0,1 a 10 L, com base em um mol da fórmula [3d].

A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -100 a 200 °C, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C.

O tempo de reação pode variar dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 24 horas.

<Método de produção de intermediário 3>

[Fórmula química 17]



em que L representa um grupo abandonador, tais como um átomo de halogênio, um grupo alquilsulfonilóxi C₁-C₄, um grupo alquilsulfonila C₁-C₄, um grupo benzilsulfonila que pode ser substituído, um grupo fenilsulfonila que pode ser substituído, um grupo fenilsulfonilóxi que pode ser substituído, ou um grupo benzilsulfonilóxi que pode ser substituído; e R¹, R², R²¹, n e X² respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; desde que quando R¹ é um grupo haloalquila, L representa um grupo abandonador tendo maior reatividade que o átomo de halogênio que permaneceu atrás da haloalquilação. Por exemplo, quando R¹ é um grupo CHF₂, L representa um átomo de cloro ou um átomo de bromo, e quando R¹ é um grupo CH₂CF₃, L representa um grupo abandonador, tais como um átomo de cloro, um átomo de bromo, um grupo p-toluenossulfonilóxi, um grupo metilsulfonilóxi ou um grupo trifluorometanossulfonilóxi.

O intermediário de produção para a fórmula [3d-1] pode ser produzido reagindo a fórmula [3e] com a fórmula [5] na presença ou ausência de uma base, em um solvente ou sem solvente.

A quantidade de uso da fórmula [5] usada no presente processo pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,01 a 100 mols, e preferivelmente 0,1 a 10 mols, com base em um mol da fórmula [3e].

Como a base que pode ser usada no presente processo, carbonatos de metal alcalino, tais como carbonato de sódio e carbonato de potássio; hidróxidos de metal alcalino, tais como hidróxido de sódio e hidróxido de potássio; hidretos de metal alcalino, tais como hidreto de potássio e hidreto de sódio; alcoólatos de metal alcalino, tais como etóxido de

sódio e metóxido de sódio; e bases orgânicas, tal como 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno podem ser incluídos, por exemplo.

A quantidade de uso da base que pode ser usada no presente processo pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0 a 100 mols, e preferivelmente 0,1 a 10 mols, com base em um mol da fórmula [3e].

Como o solvente que pode ser usado no presente processo, hidrocarbonetos halogenados, tais como diclorometano e clorofórmio; éteres, tais como éter dietílico e tetraidrofurano; hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno e tolueno; hidrocarbonetos alifáticos, tais como hexano e heptano; cetonas, tais como acetona e metil isobutil cetona; éster, tais como acetato de etila e acetato de metila; amidas, tais como N-metilpirrolidona e N,N-dimetilformamida; compostos de enxofre, tais como sulfóxido de dimetila e sulfolano; nitrilas, tal como acetonitrila; e misturas destes.

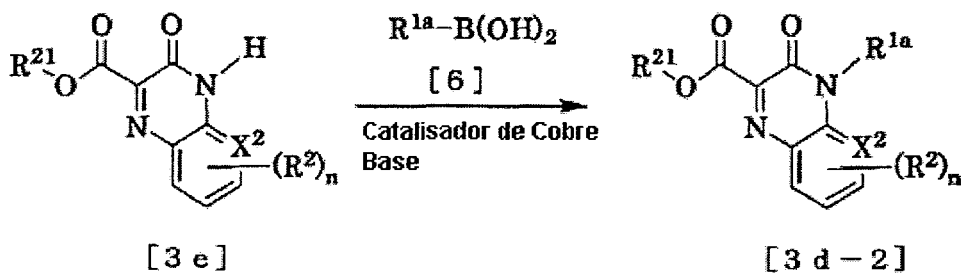
A quantidade de uso do solvente que pode ser usado no presente processo pode ser apropriadamente selecionado na faixa de 0 a 100 L, e preferivelmente 0 a 10 L, com base em um mol da fórmula [3e].

A temperatura de reação do presente processo pode ser selecionada na faixa de -100 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionado na faixa de -20 °C a 100 °C.

O tempo de reação do presente processo pode variar dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é normalmente de 1 hora a 168 horas.

<Método de produção de intermediário 4>

[Fórmula química 18]



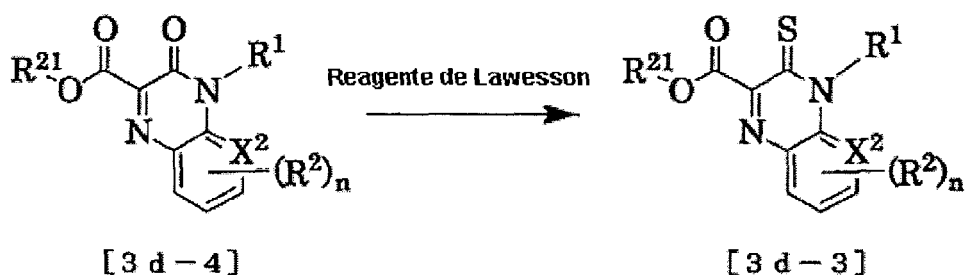
em que R^{1a} representa um grupo arila C₆-C₁₀ ou um grupo

heterocíclico tendo 2 a 10 átomos de carbono e 1 a 5 heteroátomos selecionados de um átomo de oxigênio, um átomo de enxofre e um átomo de nitrogênio; e R^2 , R^{21} , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

- 5 O intermediário de produção da fórmula [3d-2] pode ser produzido reagindo a fórmula [3e] com a fórmula [6] na presença de um catalisador de cobre e uma base de acordo com o método descrito em Tetrahedron, Vol. 55, pp. 12757-12770 (1999).

<Método de produção de intermediário 5>

[Fórmula química 19]

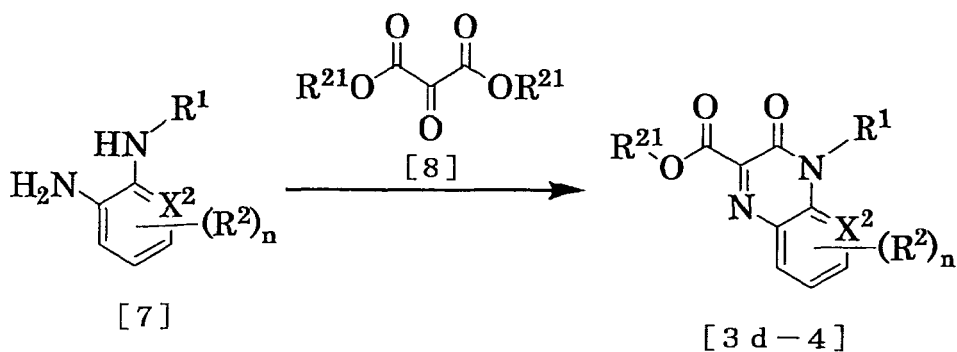


- 10 em que R^1 , R^2 , R^{21} , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

O intermediário de produção da fórmula [3d-3] pode ser produzido reagindo um composto representado pela fórmula [3d-4] com reagente de Lawesson de acordo com o método descrito em US2005/256000.

- 15 <Método de produção de intermediário 6>

[Fórmula química 20]



em que R^1 , R^2 , R^{21} , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

O intermediário de produção da fórmula [3d-4] pode ser produzido reagindo a fórmula [7] com um diéster de ácido cetomalônico representado pela fórmula [8] de acordo com os métodos descritos em US 6329389, US 6348461; Journal of the Chemical Society, pp. 430-439 (1957);
 5 WO 2005/21547, US 4296114; Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, pp. 75-84 (1987), e similares.

<Método de produção de intermediário 7>

[Fórmula química 21]

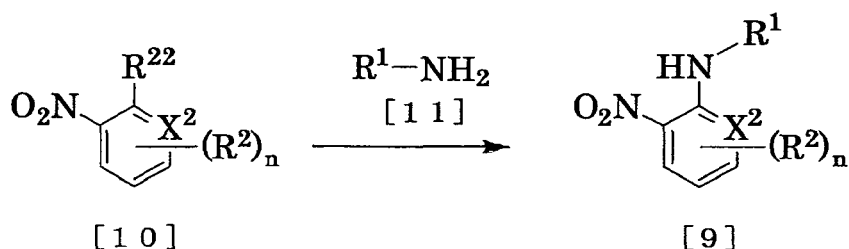


em que R^1 , R^2 , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

10 A fórmula [7] pode ser produzida reduzindo um composto nitro representado pela fórmula [9] de acordo com as descrições na Lectures on Experimental Chemistry, 4a Edição, Vol. 26, "Reduction in General", publicado por Maruzen Co., Ltd.

<Método de produção de intermediário 8>

[Fórmula química 22]



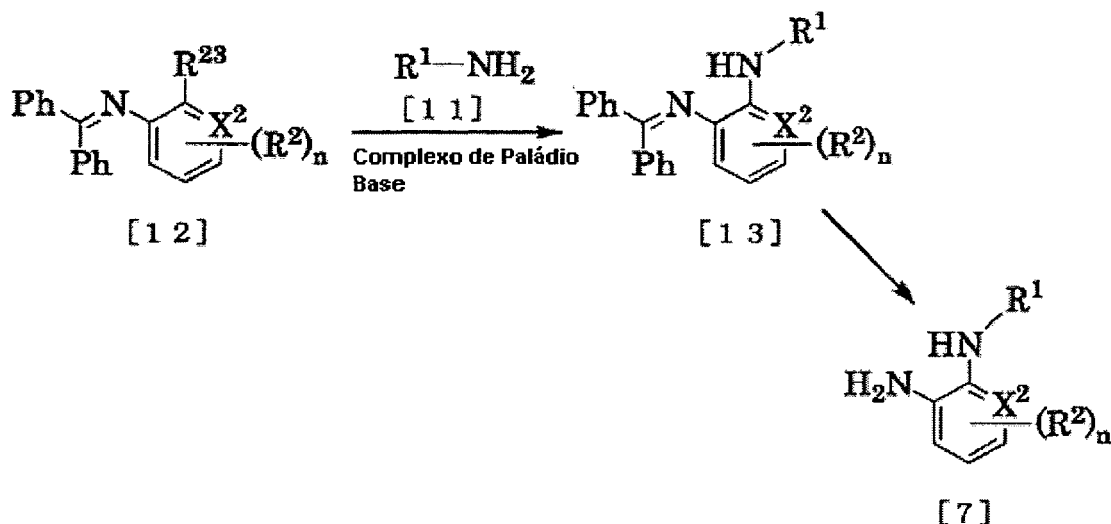
15 em que R^1 , R^2 , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; e R^{22} representa um átomo de halogênio such as um átomo de flúor, um átomo de cloro ou um átomo de bromo.

O intermediário de produção da fórmula [9] pode ser

produzido reagindo a fórmula [10] com a fórmula [11] de acordo com os métodos descritos em WO 2004/817, US 6348461; Journal of Medicinal Chemistry, Vol. 41, pp. 5457-5465 (1998); Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, pp. 2387-2391 (1980), e similares.

5 <Método de produção de intermediário 9>

[Fórmula química 23]



em que R^1 , R^2 , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; e R^{23} representa um átomo de cloro, um átomo de bromo ou um átomo de iodo.

10 O intermediário de produção da fórmula [7] pode ser produzido pelo processo descrito anteriormente.

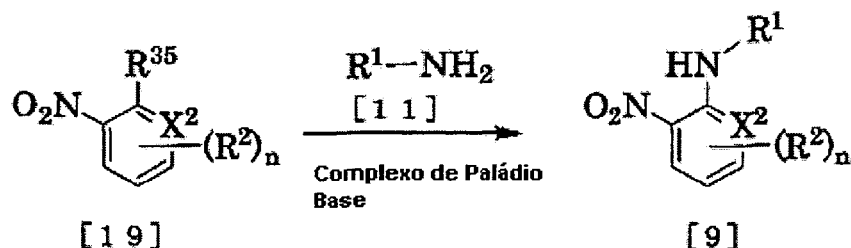
O intermediário de produção da fórmula [13] pode ser produzido reagindo um composto representado pela fórmula [12] com um composto representado pela fórmula [11] na presença de um complexo de paládio e uma base de acordo com os métodos descritos em Journal of Organic Chemistry, Vol. 65, pp. 1144-1157 (2000); Journal of Organic Chemistry, Vol. 65, pp. 1158-1174 (2000); e similares.

O intermediário de produção da fórmula [7] também pode ser produzido desprotegendo o grupo amino do composto representado pela fórmula [13] de acordo com os métodos descritos em Tetrahedron Letters, pp. 2641-2644 (1978); Synthesis, pp. 359-363; Journal of the Chemical Society, 20

Perkin Transactions 1, pp. 3081-3084 (1988); e similares.

<Método de produção de intermediário 10>

[Fórmula química 24]

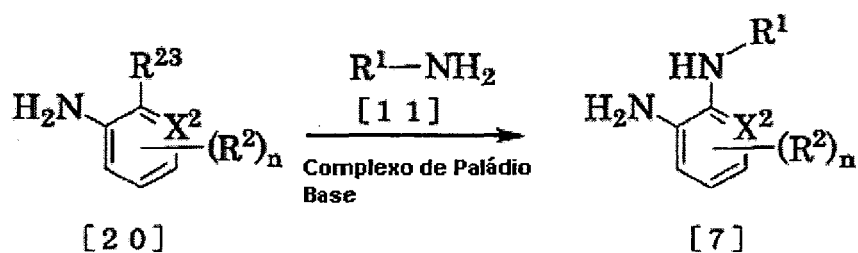


em que R^1 , R^2 , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; e R^{35} representa um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo ou um grupo trifluorometanossulfonilóxi.

O intermediário de produção da fórmula [9] pode ser produzido reagindo o composto da fórmula [19] com o composto da fórmula [11] na presença de um complexo de paládio e uma base de acordo com o método para produzir intermediário de produção da fórmula [13] em <método de produção de intermediário 9>.

<Método de produção de intermediário 11>

[Fórmula química 25]



em que R^1 , R^2 , R^{23} , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

O intermediário de produção da fórmula [7] pode ser produzido reagindo o composto da fórmula [20] com o composto da fórmula [11] na presença de um complexo de paládio e uma base de acordo com o método para produzir intermediário de produção da fórmula [13] no <método de produção de intermediário 9>.

<Método de produção de intermediário 12>

[Fórmula química 26]

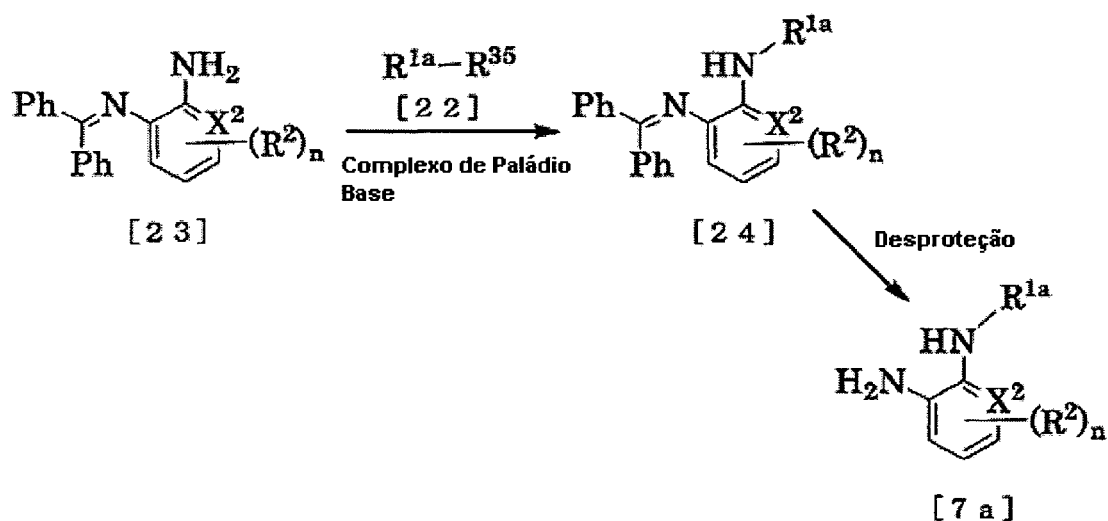


em que R^{1a} , R^2 , R^{35} , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

O intermediário de produção da fórmula [7a] pode ser produzido reagindo o composto da fórmula [21] com o composto da fórmula [22] na presença de um complexo de paládio e uma base de acordo com o método para produzir intermediário de produção da fórmula [13] no <método de produção de intermediário 9>.

<Método de produção de intermediário 13>

[Fórmula química 27]



em que R^{1a} , R^2 , R^{35} , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

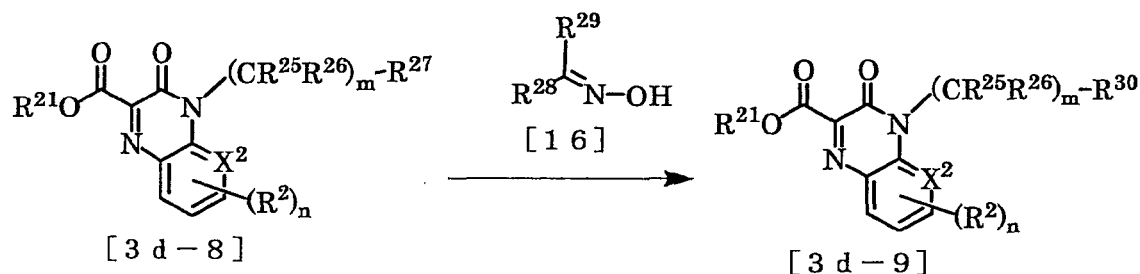
O intermediário de produção da fórmula [7a] também pode ser produzido desprotegendo o grupo amino do composto representado pela fórmula [24] que é produzido reagindo o composto da fórmula [23] com o composto da fórmula [22] na presença de um complexo de paládio e uma base de acordo com o método de produção de <método de produção de

reagindo a fórmula [3d-5] com cloreto de sulfurila de acordo com os métodos descritos em US 2003/195169; Tetrahedron Letters, Vol. 37, No. 6, pp. 759-762 (1996); e similares.

A fórmula [3d-7] pode ser produzida reagindo a fórmula [3d-6] com um composto representado pela fórmula [14] ou fórmula [15] de acordo com os métodos descritos em US 5155272, EP-1228067, US 4058392; Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, pp. 781-790 (1987); e similares.

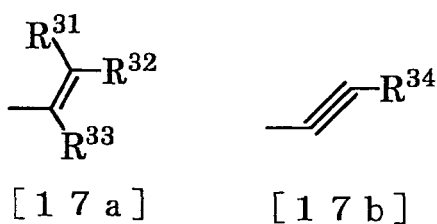
<Método de produção de intermediário 15>

[Fórmula química 29]



em que R^2 , R^{21} , X^2 e n respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente; R^{27} representa um grupo representado pela seguinte fórmula [17a] ou fórmula [17b]:

[Fórmula química 30]



R^{30} representa um grupo representado pela seguinte fórmula [18a] ou [18b]:

[Fórmula química 31]



[1 8 a]

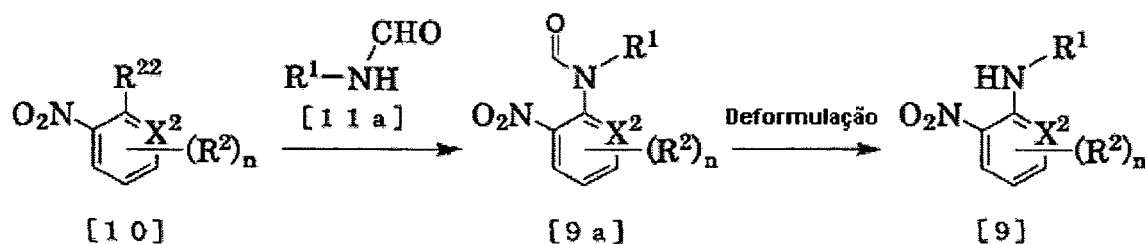
[1 8 b]

R^{25} , R^{26} , R^{31} , R^{32} , R^{33} e R^{34} cada um independentemente representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila, um grupo alquenila, um grupo alquinila, um grupo cicloalquila ou um grupo haloalquila; R^{29} representa um grupo alquila, um grupo alquenila, um grupo alquinila, um grupo alcóxi, um ciclogrupo alquila, um grupo haloalquila ou um grupo haloalquenila; R^{28} representa um átomo de halogênio; e t representa um número inteiro de 0 a 6; desde que quando R^{27} for a fórmula [17a], R^{30} seja a fórmula [18a], e quando R^{27} for a fórmula [17b], R^{30} seja a fórmula [18b].

O intermediário de produção da fórmula [3d-9] pode ser produzido reagindo a fórmula [3d-8] com a fórmula [16] de acordo com os métodos descritos em WO 2005/26123; Tetrahedron, Vol. 40, p. 2985 (1984); Synthetic Communications, Vol. 18, p. 1171 (1988); e similares.

<Método de produção de intermediário 16>

[Fórmula química 32]



em que R^1 , R^2 , R^{22} , n e X^2 respectivamente têm os mesmos significados definidos anteriormente.

O intermediário de produção da fórmula [9] também pode ser produzido pelo processo mencionado anteriormente.

O intermediário de produção da fórmula [9a] pode ser produzido reagindo a fórmula [10] com a fórmula [11a] na presença de uma

base, em um solvente ou sem solvente.

A quantidade de uso da fórmula [11a] da forma usada no presente processo pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,1 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,1 mol, com base em um mol da fórmula [10].

5 Como a base que pode ser usada no presente processo, por exemplo, carboantes de metal alcalino, tais como carbonato de sódio ou carbonato de potássio; hidróxidos de metal alcalino, tais como hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio; hidretos de metal alcalino, tais como hidreto de potássio ou hidreto de sódio; alcoolatos de metal alcalino, tais como
10 etóxido de sódio ou metóxido de sódio; ou bases orgânicas, tal como 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno e similares podem ser incluídos.

A quantidade de uso da base da forma usada no presente processo pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,1 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,1 mol, com base em um mol da fórmula [10].

15 Como o solvente que pode ser usado no presente processo, hidrocarbonetos halogenados, tais como diclorometano e clorofórmio; éteres, tais como éter dietílico e tetraidrofurano; hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno e tolueno; hidrocarbonetos alifáticos, tais como hexano e heptano; cetonas, tais como acetona e metil isobutil cetona; ésteres, tais como
20 acetato de etila e acetato de metila; amidas, tais como N-metilpirrolidona e N,N-dimetilformamida; compostos de enxofre, tais como sulfóxido de dimetila e sulfolano; nitrilas, tais como acetonitrila; e misturas destes.

A quantidade de uso do solvente que pode ser usado no presente processo pode ser apropriadamente selecionado na faixa de 0 a 100
25 L, e preferivelmente 1 a 2 L, com base em um mol da fórmula [10].

A temperatura de reação do presente processo pode ser selecionada na faixa de -100 °C à região do ponto de ebulição do solvente inerte usado, e é preferivelmente selecionada na faixa de 15 °C a 140 °C.

O tempo de reação do presente processo pode variar

dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é normalmente de 1 hora a 168 horas.

Adicionalmente, o intermediário de produção da fórmula [9] pode ser produzido deformulando a fórmula [9a] em água ou uma mistura de solventes, na presença de um ácido ou na presença de uma base.

Como a base que pode ser usada no presente processo, bases inorgânicas, tais como carbonato de potássio, hidreto de sódio e hidróxido de sódio; e bases orgânicas, tal como 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno podem ser incluídos, por exemplo.

A quantidade de uso da base pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,1 a 10 mols, e preferivelmente 1,0 a 1,2 mols, com base em um mol do composto [9a].

Como o ácido que pode ser usado no presente processo, ácidos inorgânicos, tais como ácido clorídrico, ácido bromídrico e ácido sulfúrico; e ácidos orgânicos, tais como ácido acético e ácido trifluoracético podem ser incluídos, por exemplo.

A quantidade de uso do ácido pode ser de 1 mol a um grande excesso, e preferivelmente 1 a 100 mols, com base em um mol do composto da fórmula [9a].

A mistura de solventes que pode ser usada no presente processo é uma mistura de solventes de água e um solvente orgânico, e exemplos dos solventes orgânicos incluem alcoóis, tais como metanol e etanol; éteres, tal como tetraidrofurano; cetonas, tais como acetona e metil isobutil cetona; amidas, tais como N,N-dimetilformamida e N,N-dimetilacetamida; compostos de enxofre, tais como sulfóxido de dimetila e sulfolano; acetonitrila; e misturas destes.

A quantidade de uso do solvente é 0,1 a 100 L, e preferivelmente 1,0 a 10 L, com base em um mol da fórmula [9a].

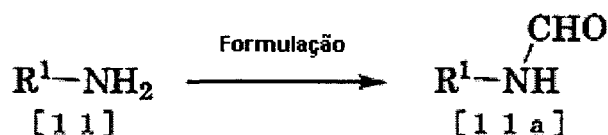
A temperatura de reação pode ser selecionada na faixa de -100

a 200 °C, e é preferivelmente selecionada na faixa de 0 °C a 100 °C.

O tempo de reação pode variar dependendo da temperatura de reação, substrato de reação, da extensão da reação e similares, mas é normalmente de 10 minutos a 24 horas.

5 <Método de produção de intermediário 17>

[Fórmula química 33]



em que R¹ tem o mesmo significado definido anteriormente.

O intermediário de produção da fórmula [11a] pode ser produzido formulando a fórmula [11] de acordo com o método descrito em Journal of the American Chemical Society, Vol. 80, pp. 1154 e
10 US2004/198981.

O herbicida e composição agroquímica da presente invenção são caracterizados por conter o derivado de oxopirazina representado pela fórmula [I] da presente invenção ou um sal agroquimicamente aceitável do mesmo, como um ingrediente ativo. A presente invenção também diz respeito
15 a uma composição agroquímica, mais particularmente uma composição herbicida, contendo o derivado de oxopirazina representado pela fórmula [I] da presente invenção, ou um ou dois ou mais de sais agroquimicamente aceitáveis destes, e um veículo usado naturalmente nas preparações agroquímicas.

20 O herbicida da presente invenção pode conter componentes aditivos (veículo) que são convencionalmente usados em preparações agroquímicas, conforme necessário.

Exemplos destes componentes aditivos incluem veículos, tais como veículos sólidos ou veículos líquidos, agentes tensoativos, aglutinantes
25 ou agentes que conferem adesividade, espessantes, corantes, agentes de extensão, agentes de espalhamento, agentes anticongelamento, agentes

antiaglutinantes, desintegrantes, estabilizantes, e similares. Além destes, antissépticos, partes de planta e similares também podem ser usados como componentes aditivos de acordo com a necessidade.

Estes componentes aditivos podem ser usados individualmente, ou também podem ser usados em combinação de duas ou mais espécies.

Os componentes aditivos mencionados anteriormente serão discutidos.

Exemplos do veículo sólido incluem minerais que ocorrem naturalmente, tais como quartzo, argila, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, argila ácida, atapulgita, zeólita e terra de diatomácea; sais inorgânicos, tais como carbonato de cálcio, sulfato de amônio, sulfato de sódio e cloreto de potássio; veículos sólidos orgânicos, tais como ácido silícico sintético, silicatos sintéticos, amido, celuloses e planta em pó; veículos plásticos, tais como polietileno, polipropileno e cloreto polivinilideno; e similares. Estes podem ser usados individualmente, ou podem ser usados em combinação de duas ou mais espécies.

Exemplos do veículo líquido incluem alcoóis que são amplamente classificados em alcoóis monoídricos, tais como metanol, etanol, propanol, isopropanol e butanol; e alcoóis poliídricos, tais como etileno glicol, dietileno glicol, propileno glicol, hexileno glicol, polietileno glicol, polipropileno glicol e glicerina; derivados de álcool poliídrico, tais como ésteres de glicol a base de propileno; cetonas, tais como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona, cicloexanona e isoforona; éteres, tais como éter etílico, dioxano, celosolve, éter dipropílico e tetraidrofurano; hidrocarbonetos alifáticos, tais como parafina normal, nafteno, isoparafina, querosene e óleo mineral; hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, tolueno, xileno, solvente nafta e alquilnaftaleno; hidrocarbonetos halogenados, tais como dicloroetano, clorofórmio e

tetraclorocarbono; ésteres, tais como acetato de etila, ftalato de diisopropila, ftalato de dibutila, ftalato de dioctila e adipato de dimetila; lactonas, tal como γ -butilolactona; amidas, tais como dimetilformamida, dietilformamida, dimetilacetamida e N-alquilpirrolidinona; nitrilas, tal como acetonitrila; compostos de enxofre, tal como sulfóxido de dimetila; óleos de planta, tais como óleo de soja, óleo de colza, óleo de semente de algodão e óleo de rícino; água; e similares. Estes podem ser usados individualmente ou podem ser usados em combinação de duas ou mais espécies.

O agente tensoativo não é particularmente limitado, mas é preferivelmente um agente tensoativo que gela ou mostra capacidade de intumescer em água. Exemplos destes incluem agentes tensoativos não iônicos, tais como ésteres de ácido graxo de sorbitano, ésteres de ácido graxo de sorbitano de polioxietileno, ésteres de ácido graxo de sacarose, ésteres de ácido graxo de polioxietileno, ésteres de ácido de resina polioxietileno, diésteres de ácido graxo de polioxietileno, éteres de alquila de polioxietileno, éteres de alquil fenila de polioxietileno, éteres de dialquilfenila de polioxietileno, condensados de éter de alquilfenila de polioxietileno-formalina, copolímeros bloco polioxietileno-polioxipropileno, éteres de polímero bloco alquil polioxietileno-polipropileno, alquilaminas de polioxietileno, amidas de ácido graxo de polioxietileno, éteres de bisfenila de ácido graxo de polioxietileno, éteres de benzil fenila de polialquileno, éteres de estiril fenila de polioxialquileno, acetilenodiol, acetilenodiol de adição de polioxialquileno, silicones tipo éter de polioxietileno, silicones tipo éster, agentes tensoativos a base de flúor, óleo de rícino de polioxietileno e óleo de rícino hidrogenado de polioxietileno; agentes tensoativos aniônicos, tais como alquil sulfatos, sulfatos de alquil éter de polioxietileno, sulfatos de alquil fenil éter de polioxietileno, sulfatos de estiril fenil éter de polioxietileno, alquil benzenossulfonatos, lignino sulfonatos, alquil sulfodsuccinatos, naftalenossulfonatos, alquil naftalenossulfonatos, sais de condensados de

ácido naftalenossulfônico-formalina, sais de condensados de ácido alquil naftalenossulfônico-formalina, sais de ácido graxo, sais de ácido policarboxílico, sarcosinato de ácido N-metil-graxo, sais de resina ácida, fosfatos de alquil éter de polioxietileno e fosfatos de alquil fenil éter de polioxietileno; agentes tensoativos catiônicos, tais como sais de alquilamina, tais como cloridratos de laurilamina, cloridratos de estearilamina, cloridratos de oleilamina, acetatos de estearilamina, acetatos de estearilaminopropilamina, cloretos de alquiltrimetilamônio e cloretos de alquildimetilbenzalcônio; agentes tensoativos anfóteros, tais como agentes tensoativos tipo aminoácido ou tipo betaína; e similares.

Estes agentes tensoativos podem ser usados individualmente, ou podem ser usados em combinação de duas ou mais espécies.

Exemplos do aglutinante ou agente que confere adesividade incluem carboximetilcelulose ou sais destes, dextrina, amido solúvel em água, goma xantana, goma guar, sacarose, polivinilpirrolidona, goma arábica, álcool polivinílico, acetato de polivinila, poliacrilato de sódio, polietileno glicol tendo um peso molecular médio de 6.000 a 20.000, óxido de polietileno tendo um peso molecular médio de 100.000 a 5.000.000, fosfolipídeos que ocorrem naturalmente (por exemplo, ácido cefálico, lecitina, etc.), e similares.

Exemplos do espessante incluem polímeros solúveis em água, tais como goma xantana, goma guar, carboximetilcelulose, polivinilpirrolidona, polímeros de carboxivinila, polímeros acrílicos, derivados de amido e polissacarídeos; pós finos inorgânicos, tais como bentonita de alta pureza e carbono branco; e similares.

Exemplos do corante incluem pigmentos inorgânicos, tais como óxido de ferro, óxido de titânio e azul da Prússia; pigmentos orgânicos, tais como corantes de alizarina, corantes azo e corantes de ftalocianeto de metal; e similares.

Exemplos do agente de extensão incluem agentes tensoativos a

base de silicone, celulosas em pó, dextrina, amido processado, compostos de quelato de ácido poliaminocarboxílico, polivinilpirrolidona reticulada, ácido maléico e estirenos, copolímeros de ácido metacrílico, meio ésteres de um polímero de álcool poliídrico e um anidrido de ácido dicarboxílico, sais solúveis em água de ácido poliestirenosulfônico, e similares.

Exemplos do agente de espalhamento incluem vários agentes tensoativos, tais como dialquilsulfosuccinato de sódio, polioxietileno alquil éteres, polioxietileno alquil fenil éteres e ésteres de ácido graxo de polioxietileno; parafinas, terpenos, resinas de poliamida, poliacrilatos, polioxietileno, ceras, alquil éteres de polivinila, condensados de alquilfenol-formalina, emulsões de resina sintética e similares.

Exemplos do agente anticongelamento incluem alcoóis poliídricos, tais como etileno glicol, dietileno glicol, propileno glicol e glicerina; e similares.

Exemplos do agente antiaglutinante incluem polissacarídeos, tais como amido, ácido algínico, manose e galactose; polivinilpirrolidona, carbono branco, gomas de éster, resinas de petróleo e similares.

Exemplos dos desintegrantes incluem tripolifosfato de sódio, hexametáfosfato de sódio, sais de metal de ácido esteárico, celulose em pó, dextrina, copolímeros de ésteres de ácido metacrílico, polivinilpirrolidona, compostos de quelato de ácido poliaminocarboxílico, copolímeros de estireno sulfonado-isobutileno-anidrido maléico, copolímeros de enxerto de amido-poliacrilonitrila e similares.

Exemplos do estabilizante incluem agentes de secagem, tais como zeólitas, cal virgem e óxido de magnésio; antioxidantes do tipo fenol, tipo amina, tipo enxofre, tipo ácido fosfórico e similares; absorventes de ultravioleta de tipo de ácido salicílico, tipo benzofenona e similares; e similares.

Exemplos do antisséptico incluem sorbato de potássio, 1,2-

benzotiazolin-3-ona e similares.

Exemplos das partes da planta incluem serragem, casca de coco, sabugo de milho, caule de tabaco e similares.

No caso de incorporar os componentes aditivos no herbicida da presente invenção, a proporção do teor é selecionada na faixa normalmente de 5 a 95 %, e preferivelmente 20 a 90 %, para o veículo; normalmente 0,1 % a 30 %, e preferivelmente 0,5 a 10 %, para o agente tensoativo; e normalmente 0,1 a 30 %, e preferivelmente 0,5 a 10 %, para outros aditivos, todos com base na massa do herbicida.

O herbicida da presente invenção é usado depois de ser formulado em qualquer formulação, tais como uma formulação líquida, um concentrado emulsificável, uma formulação de pó umectável, uma formulação de polvilho, uma formulação de óleo, uma formulação de grânulo dispersível em água, uma formulação que pode ser escoável, uma suspensão emulsificada, uma formulação de grânulo, uma formulação jumbo, uma suspoemulsão ou uma formulação Mametsubu (marca registrada).

Durante esta formulação, o herbicida pode ser preparado em uma composição misturada com pelo menos um dos produtos agroquímicos, tais como outros herbicidas, inseticidas, bactericidas e reguladores do crescimento da planta, protetores, um fertilizante e similares, ou o herbicida pode ser usado em combinação com estes componentes.

Na hora do uso, o herbicida da presente invenção pode ser diluído para uma concentração apropriada e aspergido, ou pode ser diretamente aplicado.

O derivado de oxopirazina representado pela fórmula [I] da presente invenção ou um sal agroquimicamente aceitável do mesmo pode ser usado sozinho como um ingrediente ativo, mas também pode ser usado como uma mistura ou em combinação com outros ingrediente ativos.

Exemplos de compostos herbicidas conhecidos e reguladores

do crescimento da planta que podem ser misturados ou usados em combinação serão listados no seguinte.

- 2,3,6-TBA, 2,4-D, 2,4-DB, DNOC, EPTC, etoxifen-etila, MCPA, MCPA-tioetila, MCPB, S-metolaclor, TCA, ioxinil, aclonifen,
- 5 azafenidin, acifluorfen, azimsulfuron, asulam, acetoclor, atrazina, anilofos, amicarbazona, amidosulfuron, amitrol, aminopiridid, amiprofos-metila, ametrin, alaclor, alloxidim, ancimidol, iodosulfuron-metil-sódio, isouron, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxaben, isoproturon, imazaquin, imazapir, imazamethabenz-metila, imazapic, imazamox, imazetapir, imazosulfuron,
- 10 indanofan, esprocarb, etametsulfuron-metila, etalfluralin, etidimuron, etoxissulfuron, etofumesato, etobenzanid, oxadiazon, oxadiargila, oxaziclomefona, oxasulfuron, oxifluorfen, orizalin, orbencarb, cafenstrol, carfentrazone-etila, carbutilato, carbetamida, quizalofop, quizalofop-P-etila, quizalofop-P-tefurila, quizalofop-etila, quinclorac, quinmerac, cumyluron,
- 15 glifosato, glifosato-trimesium, glufosinato-amônio, glufosinato-sódio, clethodim, clodinafop-propargila, clopiralid, clomazona, chlometoxifen, clomeprop, cloransulam-metila, cloramben, cloridazon, clorimuron-etila, clorsulfuron, clorthal-dimetila, clortiamid, clorpropham, clorimequat clorida, cloroxuron, clorotoluron, clorobromuron, cianoazina, diuron, dicamba,
- 20 cicloate, cicloxydim, diclosulam, ciclosulfamuron, dichlobenil, diclofop-metila, diclorprop, diclorprop-P, dibrometo de diquat, ditiopir, siduron, dinitramina, cinidon-etila, cinosulfuron, dinoseb, dinoterb, cyhalofop-butila, difenamid, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflumentorim, simazina, dimetaclor, dimetametrin, dimethenamid, simetryn, dimepiperato, dimefuron,
- 25 cinmetilin, sulcotriona, sulfentrazone, sulfosulfuron, sulfometuron-metila, sethoxydim, terbacil, daimuron, dalapon, tiazopir, tiocarbazil, tiobencarb, thidiazimin, thidiazuron, thifensulfuron-metila, desmedipham, desmetryne, thenylclor, tebutam, tebuthiuron, tepraloxymid, tefuryltrion, terbuthylazina, terbutryn, terbumeton, tembotriona, topamezona, tralkoxydim, triaziflam,

triasulfuron, triallate, trietazina, triclopir, triflusulfuron-metila, tritosulfuron, trifluralin, trifloxysulfuron-sódio, tribenuron-metila, naptalam, naproanilida, napropamida, nicosulfuron, neburon, norflurazon, vernolato, dicloreto de paraquat, haloxyfop, haloxyfop-P-metila, halosulfuron-metila, pinoxaden,

5 picloram, picolinafen, bispiribac-sódio, bifenox, piperophos, piraclonil, pirasulfotol, pirazoxifen, pirazosulfuron-etila, pirazolinato, bilanafos, piraflufen-etila, piridafol, piritiobac-sódio, piridato, piriftalid, piributicarb, piribenzoxim, pirimisulfan, primisulfuron-metila, piriminobac-metila, piroxysulam, fenuron, fenoxaprop-P-etila, fenoxaprop-etila, fenclorim,

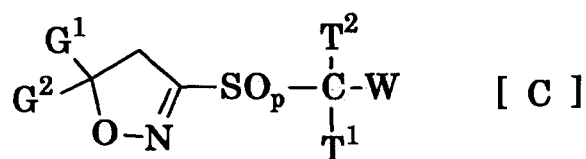
10 fentrazamida, fenmedipham, foramsulfuron, butaclor, butafenacil, butamifos, butilato, butralin, butroxydim, flazasulfuron, flamprop-M, fluazifop-butila, fluazifop-P-butila, fluazolato, fluometuron, fluoroglicofen-etila, flucarbazona-sódio, flucetosulfuron, flutiacet-metila, flupirsulfuron-metil-sódio, flufenacet, flufenpir-etila, flupropanato, flupoxame, flumioxazin, flumiclorac-pentila,

15 flumetsulam, fluridona, flurtamona, flurprimidol, fluroxypir, flurcloridona, pretilaclor, prodiamina, prosulfuron, prosulfocarb, propaquizafop, propaclor, propazina, propanil, propizamida, propisoclor, propham, profluazol, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sódio, profoxidim, bromacil, prometryn, prometon, bromoxinil, bromofenoxim, bromobutida, florasulam, hexazinona,

20 pethoxamid, benazolin, penoxsulam, beflubutamid, pebulato, bencarbazona, pendimetalin, benzfendizona, bensulida, bensulfuron-metila, benzobiciclon, benzofenap, bentazona, pentanoclor, pentoxazona, benfluralin, benfuresato, fosamina, fomesafen, forclorfenuron, hidrazida maléica, mecoprop, mecoprop-P, mesosulfuron-metila, mesotriona, metazaclor, metabenzthiazuron,

25 metamitron, metamifop, metil-dimuron, metoxuron, metosulam, metsulfuron-metila, metobromuron, metobenzuron, metolaclor, metribuzin, mepiquat clorida, mefenacet, monolinuron, molinato, lactofen, linuron, rimsulfuron, lenacil, prohexadiona-calcium, trinexapac-etila, piroxasulfona, um derivado de isoxazolina representado pela seguinte fórmula [C]:

[Fórmula química 34]



em que p representa um número inteiro de 0 a 2; T1 e T2 cada um independentemente representa um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo alcóxicarbonila inferior ou um grupo alquila C₁-C₆; G1 e G2 cada um independentemente representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C₁-C₆ ou um grupo haloalquila C₁-C₆; W representa um grupo fenila (substituído por 1 a 5 V idênticos ou diferentes); e V representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C₁-C₆ {que pode ser substituído por 1 a 3 átomos de halogênio idênticos ou diferentes, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo hidroxila, um grupo alquiltio C₁-C₆, um grupo alquilsulfinila C₁-C₆, um grupo alquilsulfonila C₁-C₆, um C₁-C₆ alquilgrupo amino, um C₁-C₆ dialquilgrupo amino, um ciano grupo ou um grupo fenóxi (que pode ser substituído)}, um grupo alcóxi C₁-C₆ (que pode ser substituído por 1 a 3 átomos de halogênio idênticos ou diferentes, um grupo alcóxi C₁-C₆, um grupo alquenila C₂-C₆, um grupo alquinila C₂-C₆, um grupo alcóxicarbonila C₁-C₆, um grupo alquilcarbonila C₁-C₆ ou um grupo cicloalquila C₃-C₈), um grupo cicloalquilóxi C₃-C₈ ou um átomo de halogênio,

e similares podem ser incluídos.

Além disso, exemplos de compostos bactericidas conhecidos que podem ser misturados ou usados em combinação serão listados a seguir

Benomila, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato, tiofanato-metila, clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenarimol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalil, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, nuarimol, oxpoconazol fumarato, paclobutrazol,

pefurazoato, penconazol, procloraz, propiconazol, protioconazol, pirifenox,
 simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triflumizol,
 triforina, triticonazol, benalaxila, furalaxila, mefenoxam, metalaxila,
 metalaxil-M, ofurace, oxadixila, aldimorf, dodemorf, fenpropidin,
 5 fenpropimorf, piperalin, spiroxamina, tridemorf, edifenphos, iprobenfos,
 isoprotiolane, pirazophos, benodanil, boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil,
 furametpir, mepronil, oxicarboxin, pentiopirad, thifluzamida, bupirimato,
 dimetirimol, etirimol, ciprodinil, mepanipirim, pirimetanil, diethofencarb,
 azoxistrobina, dimoxystrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona,
 10 fluoxastrobina, kresoxim-metila, metominostrobin, orisastrobina,
 picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina, fenpiclonil, fludioxonil,
 quinoxifen, bifenila, cloroneb, dicloran, etridiazol, quintozeno, tecnazeno,
 tolclofos-metila, ftalida, piroquilon, triciclazol, carpropamid, diclocimet,
 fenoxanil, fenexamid, piributicarb, polioxin, pencicuron, ciazofamid,
 15 zoxamida, blasticidin-S, kasugamicina, estreptomicina, validamicina,
 cimoxanil, iodocarb, propamocarb, protiocarb, binapacril, dinocap,
 ferimzona, fluazinam, TPTA (acetato de fentina), TPTC (cloreto de fentina),
 TPTH (hidróxido de fentina), ácido oxolínico, himexazol, octilinona, fosetila,
 ácido fosfórico e sais destes, tecloftalam, triazoxida, flusulfamida,
 20 diclomezina, siltiofam, diflumentorim, bentiavalicarb-isopropila, dimetomorf,
 flumorf, iprovalicarb, mandipropamid, oxitetraciclina, metassulfocarb,
 chinometionato, fluorimida, milneb, hidróxido de cobre, octanoato de cobre,
 oxicloreto de cobre, sulfato de cobre, óxido cuproso, mancopper, oxina-cobre,
 enxofre, ferbam, mancozeb, maneb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram,
 25 captafol, captan, folpet, clorotalonil, diclofluanid, tolylfluanid, anilazina,
 dodina, guazatina, iminoctadina, ditianon, acibenzolar-S-metila, probenazol,
 tiadinil, etaboxam, ciflufenamid, proquinazid, metrafenona, fluopicolida,
 dazomet, difenzoquat, amisubrom, mistura de Bordeaux, F-991, nabam, óxido
 de fenazina, policarbamato, piribencarb, e similares podem ser incluídos.

Exemplos de compostos inseticidas e nematocidas conhecidos que podem ser misturados ou usados em combinação serão listados a seguir.

Acetamiprid, clotianidin, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid, tiamethoxam, etiprol, fipronil, acetoprol, chromafenozida, halofenozida, metoxifeno-
 5 zida, tebufenozida, acrinatrin, alletrin, alfa-cipermetrin, beta-ciflutrin, beta-cipermetrin, bifentrin, bioalletrin, bioresmetrin, cicloprotrin, ciflutrin, cialotrin, cipermetrin, cifenotrin, deltametrin, empentrin, esfenvalerato, fenpropatrin, fenvalerato, flucitrinato, flumetrin, gama-cialotrin, imiprotrin, lambda-cialotrin, metotrin,
 10 permetrin, fenotrin, pralletrin, resmetrin, kadetrin, tau-fluvalinato, teflutrin, tetrametrin, zeta-cipermetrin, tralometrin, transflutrin, etofenprox, halfenprox, silafluofen, bensultap, cartap, tiociclam, tiosultap-sódio, acefato, azametifos, azinfos-etila, azinfos-metila, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metila, coumafos, cianofos, demeton-S-
 15 metila, diazinon, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dissulfoton, EPN, etion, ethoprofos, famphur, fenamifos, fenitrothion, fention, fostiazato, heptenofos, isocarbofos, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, omethoato, oxidemeton-metila, paration, paration-metila, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon,
 20 foxim, pirimifos-metila, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorevinfos, tiometon, triazofos, triclofon, vamidotin, imiciafos, flupirazofos, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbarila, carbofurano, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb,
 25 metiocarb, methomila, metolcarb, oxamila, pirimicarb, propoxur, trimetacarb, XMC, xililcarb, alanicarb, butocarboxim, butoxicarboxim, tiodicarb, tiofanox, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron, abamectin, emamectin, clorfenapir, fenoxicarb, hidropreno,

kinopreno, metopreno, piriproxifen, dienoclor, cienopirafen, ciflumetofen, espiromesifen, espiroclorfen, espirotetramat, flubendiamida, flurimfen (flufenimer), flonicamid, metaflumizon, rinaxypir, lepmectina, piridalia, fluacripirim, indoxacarb, bromopropilato, triazamato, fenazaquin, fenpiroximato, piridaben, tebufenpirad, clofentezina, etoxazol, hexitiazox, pimetrozina, buprofezin, 1.3-dicloropropeno (1.3-D), isocarbofos, N-metilditiocarbamato de amônio (NCS), azociclotin, endosulfan, clordano, cloropicrin, ciexatin, spinosad, dimetilditiocarbamato de sódio, óxido de fenbutatina, flusulfamida, isotiocianoato de metila (MITC), rotenona, CL900167, fluoreto de sódio e alumínio, pirifluquinazon, RU-15525, XDE-175, ZXI-8901 e similares podem ser incluídos.

Exemplos de protetores conhecidos que podem ser misturados ou usados em combinação serão listados a seguir.

Benoxacor, furilazol, diclormid, diciclonona, DKA-24 (N1,N2-diallyl-N2-dicloroacetilglicinamida), AD-67 (4-dicloroacetil-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano), PPG-1292 (2,2-dicloro-N-(1,3-dioxan-2-ilmetil)-N-(2-propenil)acetamida), R-29148 (3-dicloroacetil-2,2,5-trimetil-1,3-oxazolidina), cloquintcet-mexila, anidrido 1,8-naftálico, mefenpir-dietila, mefenpir, fenclorazol-etila, fenclorim, MG-191 (2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxano), ciometrinil, flurazol, fluxofenim, isoxadifen-etila, mecoprop, MCPA, daimuron, 2,4-D, isoxadifen, MON4660, oxabetrinil, ciprosulfamida, e similares podem ser incluídos.

A proporção de incorporação do ingrediente ativo no herbicida da presente invenção é apropriadamente selecionada de acordo com a necessidade e pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,01 a 10 % em peso, e preferivelmente 0,05 a 5 % em peso, no caso de uma formulação de polvilho ou uma formulação de grânulo. A proporção de incorporação pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 1 a 50 % em peso, e preferivelmente 5 a 30 % em peso, no caso de uma formulação de emulsão ou

pó umectável. A proporção de incorporação pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 1 a 40 % em peso, e preferivelmente 5 a 30 % em peso, no caso de uma formulação escoável e similares.

5 A quantidade de aplicação do herbicida da presente invenção pode variar dependendo do tipo do composto usado, erva daninha a ser tratada, tendência de ocorrência, condições ambientais, formulação usada e similares, mas no caso de usar o herbicida diretamente, tal como na forma de uma formulação de póvilho ou uma formulação de grânulo como ela é, a quantidade de aplicação pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 1 g
10 a 50 kg, e preferivelmente 10 g a 10 kg, por um hectare em termos do ingrediente ativo. No caso de usar o herbicida no estado líquido, tal como na forma de um concentrado emulsificável, uma formulação de pó umectável ou uma formulação escoável, a quantidade de aplicação pode ser apropriadamente selecionada na faixa de 0,1 a 50.000 ppm, e preferivelmente
15 10 a 10.000 ppm.

O herbicida da presente invenção pode ser usado através de aplicação nas folhas, aplicação no solo ou aplicação submersa, a campos não plantados, campos de arroz, pomares e similares. O herbicida da presente invenção também pode ser usado para o propósito de controlar ervas daninhas
20 gerais em campos não aproveitados, sulcos entre campos de arroz, estradas de fazenda, trincheiras de drenagem, pastos reaproveitados, solos de cimetério, parques públicos, ruas, pátios, lotes vazios em volta de construções, terras reaproveitadas, finais de trilha, florestas e similares.

O herbicida da presente invenção apresenta excelente efeito
25 herbicida em uma ampla faixa de período de pré-emergência ao crescimento de ervas daninhas incluindo, por exemplo, *Persicaria* spp., tais como *Poligonum lapathifolium* L., *Poligonum longisetum* De Bruyn e *Rumex japonicus* Houtt.; *Amaranthus* spp., tais como *Amaranthus viridis* L., *Amaranthus palmeri* S. Wats. e *Amaranthus retroflexus* L.; ervas daninhas de

- folhas largas, tais como *Solanum carolinense* L., *Solanum nigrum* L., *Chenopodium album* L., *Abutilon theophrasti* medicus, *Sida spinosa* L., *Sesbania exaltata* Cory, *Ambrosia elatior* L., *Papaver rhoeas* L., *Ipomoea* spp., *Xanthium strumarium* L., *Stellaria media* Villars, *Matricaria chamomilla* L.,
- 5 *Galium spurium* L. var. *echinospermon* Hayek, *Viola mandshurica*, *Veronica persica* Poiret, *Veronica hederifolia* L., *Lamium amplexicaule* L., *Vicia angustifolia* L., *Senecio vulgaris* L., e *Capsella Bursa-pastoris* (L.) medik; ervas daninhas ciperáceas perenes ou anuais, tais como *Cyperus rotundus* L., *Cyperus esculentus* L., *Cyperus brevifolius* Hassk. var. *leiolepis* T. Koyama,
- 10 *Cyperus microiria* Steud., e *Cyperus iria*; e ervas daninhas graminosas, tais como *Echinochloa esculenta* (A. Braun) H. Scholz, *Digitaria ciliaris* (Retz.) Koel., *Setaria viridis* (L.) P. Beauv., *Poa annua* L., *Alopecurus aequalis* Sobol. var. *amurensis* Ohwi, *Sorghum halepense* Pers., *Alopecurus myosuroides* Huds., *Lolium multiflorum* Lamarck., e *Avena sativa* L. O herbicida da
- 15 presente invenção também pode controlar ervas daninhas anuais que crescem em campos de arroz, tais como *Echinochloa oryzicola* Vasing, *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. var. *crus-galli*, *Cyperus difformis* L., *Leptochloa chinensis* (L.) Nees, *Monochoria vaginalis* (Burm. f.) Presl var. *plantaginea* (Roxb.) Solms-Laub., *Lindernia dubia* (L.) Pennell, *Lindernia procumbens* (Krock.) Philcox., *Rotala indica* (Willd.) Koehne var. *uliginosa* (Miq.) Koehne, *Vandellia angustifolia* Benth., *Limnophila sessiliflora*, *Ammannia multiflora* Roxb., *Elatine triandra* Schk. var. *pedicellata* Krylov., *Monochoria korsakowii* Regel et Maack, *Ludwigia prostrata* Roxb., *Eclipta prostrata* L., *Bidens frondosa* L., *Aeschynomene indica* L., e *Murdannia keisak* Hand-
- 25 Mazz.; e ervas daninhas perenes, tais como *Sagittaria pygmaea* Miq., *Sagittaria trifolia* L., *Cyperus serotinus* Rottb., *Eleocharis kuroguwai* Ohwi, *Scirpus juncoides* Roxb., *Alisma canaliculatum* A. Br. et Bouche, *Potamogeton distinctus* A. Bennett, *Leersia japonica* Makino, *Paspalum distichum* L., *Leersia oryzoides* (L.) Swartz, e *Eleocharis acicularis* Roem. et

Schult. var. longiseta Svenson.

Além disso, o herbicida da presente invenção é altamente seguro para plantas úteis e lavouras úteis, e apresenta alta segurança, por exemplo, para lavouras, tais como arroz, trigo, cevada, aveia comum, centeio, milho rabo-de-raposa, milho comum, milho e sorgo de grão; soja, algodão, beterraba, cana de açúcar, cebola, girassol, óleo de semente de colza, amendoim, linho, tabaco, café, batata doce, batata, tomate e outros vegetais ou gramados e similares.

As lavouras úteis e plantas úteis da forma aqui usada incluem as então chamadas lavouras e plantações geneticamente modificadas que foram transformadas por tecnologias de engenharia genética para apresentar resistência aos herbicidas, pragas, doenças e similares, tais como milho, soja, algodão, óleo de semente de colza e cana de açúcar; e plantas que apresentam resistência aos herbicidas, pragas, doenças e similares por meio de seleção.

Daqui em diante, o método para produzir o composto da fórmula [I] de acordo com a presente invenção, exemplos de preparação e usos serão ilustrados em detalhes pelos seguintes exemplos, mas não devem ser considerados limitantes destes. Além do mais, na seguinte descrição, “%” representa porcentagem em peso, e “partes” representa partes em peso.

[Exemplo 1]

Produção de 3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-metilquinoxalin-2(1H)-ona (Composto No. I-2 da invenção (ver tabela 1))

(1) Produção de 3-oxo-1-cicloexenil 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato

4,6 g (22,5 mmol) de ácido 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico foram dissolvidos em diclorometano (200 mL), e N,N-dimetilformamida (0,5 mL) e 4,3 g (33,9 mmol) de cloreto de oxalila foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 1 hora a temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada em pressão

reduzida, e o resíduo obtido foi dissolvido em diclorometano (100 mL). Esta solução foi adicionada em gotas a temperatura ambiente a uma solução preparada dissolvendo 2,8 g (25,0 mmol) de 1,3-cicloexanodiona e 2,7 g (26,7 mmol) de trietilamina em diclorometano (100 mL). A mistura foi agitada por 1 hora a temperatura ambiente, e então, a mistura de reação foi lavada com água, e seca sobre sulfato de sódio anidro. A matéria inorgânica foi separada por filtração, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida, para obter 6,3 g (rendimento 94 %) de 3-oxo-1-cicloexenil 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato na forma de um sólido amarelo.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)): 2,11-2,18(2H,m), 2,46-2,49(2H,m), 2,76-2,78(2H,m), 3,77(3H,s), 6,13(1H,s), 7,39-7,47(2H,m), 7,73(1H,t), 8,00(1H,d)

(2) Produção de 3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-metilquinoxalin-2(1H)-ona

6,3 g (21,1 mmol) de 3-oxo-1-cicloexenil 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato foi dissolvido em diclorometano (100 mL), e a esta solução, 2,4 g (23,7 mmol) de trietilamina e cianidrina de acetona (1 mL) foram adicionados. A mistura foi agitada por um dia a temperatura ambiente. A mistura de reação foi lavada com ácido clorídrico 10 % e seca sobre sulfato de sódio anidro, e o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo foi recristalizado a partir de metanol, para obter 4,3 g (rendimento: 68 %) de 3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-metilquinoxalin-2(1H)-ona na forma de um pó branco (ponto de fusão 191 a 192 °C).

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)): 2,05-2,12(2H,m), 2,45-2,47(2H,m), 2,76-2,80(2H,m), 3,71(3H,s), 7,33-7,38(2H,m), 7,60(1H,t), 7,85(1H,d), 16,3(1H,s)

[Exemplo 2]

Produção de 2-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-4-fenilpirido[2,3-b]pirazin-3(4H)-ona (Composto No. IV-1 da invenção (ver tabela

38))

6,50 g (24 mmol) de ácido 3-oxo-4-fenil-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico foi dissolvido em diclorometano (100 mL), e a esta solução, N,N-dimetilformamida (0,5 mL) e 3,8 g (30 mmol) de cloreto de oxalila foram adicionados sequencialmente. A mistura foi agitada por uma hora a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo obtido foi dissolvido em diclorometano (30 mL), e esta solução foi adicionada em gotas a 0 °C por 5 minutos a uma solução preparada dissolvendo 2,7 g (24 mmol) de 1,3-cicloexanodiona e 2,5 g (24 mmol) de trietilamina em diclorometano (30 mL). A solução de reação retornou para temperatura ambiente e foi agitada por 3 horas, e então cianoidrina de acetona (1 mL) e 2,5 g (24 mmol) de trietilamina foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 12 horas a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, água (50 mL) foi adicionada à solução de reação, a solução de reação foi ajustada para pH 12 usando uma solução aquosa 10 % de hidróxido de sódio, e a solução de reação foi separada. A camada aquosa foi ajustada para pH 1 adicionando ácido clorídrico 6 N, e então a camada aquosa foi extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi seca sobre sulfato de magnésio anidro, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi lavado com metanol, para obter 6,5 g (rendimento: 73 %) de 2-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-4-fenil-pirido[2,3-b]pirazin-3(4H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)): 2,06(2H, t), 2,44(2H, s), 2,77(2H, t), 7,30(3H, d), 7,53(3H, m), 8,18(1H, m), 8,47(1H, d), 16,10(1H,s)

[Exemplo 3]

Produção de 2-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-4-(4-metoxifenil)-pirido[2,3-b]pirazin-3(4H)-ona (Composto No. IV-62 da invenção (ver tabela 39))

4,4 g (15 mmol) de ácido 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-

diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico foi dissolvido em diclorometano (100 mL), e a esta solução, N,N-dimetilformamida (0,5 mL) e 3,8 g(30 mmol) de cloreto de oxalila foram adicionados sequencialmente. A mistura foi aquecida a refluxo por uma hora mantendo agitação. Depois de confirmar que a reação foi completa, a solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi dissolvido em diclorometano (30 mL), e esta solução foi adicionada em gotas a 0 °C por 5 minutos a uma solução preparada dissolvendo 1,8 g (16 mmol) de 1,3-cicloexanodiona e 1,8 g (18 mmol) de trietilamina em diclorometano (30 mL). A solução de reação retornou para temperatura ambiente e foi agitada por 3 horas, e então cianidrino de acetona (1 mL) e 1,8 g (18 mmol) de trietilamina foram ainda adicionados a ela. A mistura foi agitada por 12 horas a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, água (20 mL) foi adicionada à solução de reação, a solução de reação foi ajustada para pH 12 usando uma solução aquosa 10 % de hidróxido de sódio, e a solução de reação foi separada. A camada aquosa foi ajustada para pH 1 adicionando ácido clorídrico 6 N, e então a camada aquosa foi extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi seca sobre sulfato de magnésio anidro, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi lavado com metanol, para obter 4,5 g (rendimento: 78 %) de 2-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-4-(4-metoxifenil)-pirido[2,3-b]pirazin-3(4H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,06(2H, s), 2,44(2H, s), 2,77(2H, t), 3,86(3H, s), 7,07(2H, d), 7,28(2H, d), 8,17(1H, d), 8,49(1H, d)

[Exemplo 4]

Produção de 3-hidróxi-2-(1-metil-2-tioxo-1,2-diidroquinoxalin-3-il-carbonil)-2-cicloexen-1-ona (Composto No. I-256 da invenção (ver tabela 11))

2,4 g (10,3 mmol) de 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila e 4,2 g (10,4 mmol) de reagente de Lawesson foram adicionados ao tolueno (50 mL), e a mistura foi agitada por um dia mantendo a temperatura do líquido a 100 °C. A mistura de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida. Clorofórmio foi adicionado ao resíduo, o insolúvel foi separado por filtração, e o filtrado foi concentrado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi dissolvido em etanol (300 mL), 4,9 g de uma solução aquosa 25 % de hidróxido de sódio foi adicionada a temperatura ambiente, e a mistura foi agitada por um dia a temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada em pressão reduzida, água foi adicionada à mesma, e a mistura foi ajustada para pH 1 usando ácido clorídrico 10 %. Um precipitado sólido foi coletado por filtração, e foi lavado com água. O sólido assim obtido foi seco, e este sólido foi dissolvido em clorofórmio (50 mL). 1,7 g (13,4 mmol) de cloreto de oxalila e uma gotícula de N,N-dimetilformamida foram adicionados à solução, e a solução de reação foi agitada por 2 horas a temperatura ambiente, e concentrada em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi dissolvido em clorofórmio (20 mL), 0,84 g (7,49 mmol) de 1,3-cicloexanodiona e 0,83 g (8,20 mmol) de trietilamina foram adicionados a ele, e a mistura foi agitada por uma hora a temperatura ambiente. 0,83 g (8,20 mmol) de trietilamina e 0,64 g (7,52 mmol) de cianidrina de acetona foram ainda adicionados a temperatura ambiente, e a mistura foi agitada por dois dias a temperatura ambiente. A mistura de reação foi lavada com ácido clorídrico 10 %, e seca sobre sulfato de magnésio anidro, e o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia em gel de sílica (solvente de desenvolvimento: acetato de etila/clorofórmio = 1/1). O sólido resultante foi lavado com acetato de etila, para obter 0,40 g de 3-hidróxi-2-(1-metil-2-tioxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carbonil)-2-cicloexen-1-ona na forma de um pó amarelo (ponto de fusão 300

°C ou mais).

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,01-2,11(2H,m), 2,38-2,44(2H,m), 2,75-2,81(2H,m),
4,19(3H,s), 7,44(1H,t), 7,55(1H,d), 7,68(1H,t), 7,88(1H,d), 16,3(1H,s)

5 [Exemplo 5]

Produção de 5-flúor-3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-(4-metoxifenil)-quinoxalin-2(1H)-ona (Composto No. II-186 da invenção (ver tabela 24))

10 11,1 g (35 mmol) de ácido 5-flúor-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico foi dissolvido em clorofórmio (300 mL), e a esta solução, N,N-dimetilformamida (0,5 mL) e 6,7 g (53 mmol) de cloreto de oxalila foram adicionados sequencialmente. A mistura foi agitada por uma hora a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim
15 obtido foi dissolvido em clorofórmio (100 mL), e esta solução foi adicionada em gotas a 0 °C por 5 minutos a uma solução preparada dissolvendo 4,4 g (39 mmol) de 1,3-cicloexanodiona e 4,3 g (43 mmol) de trietilamina em clorofórmio (200 mL). A solução de reação retornou para temperatura ambiente e foi agitada por 3 horas, e então 1,5 g (18 mmol) de cianoidrina de
20 acetona e 4,3 g (43 mmol) de trietilamina foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 12 horas a temperatura ambiente. A solução de reação foi lavada com ácido clorídrico 10 % e seca sobre sulfato de sódio anidro, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi lavado com metanol, para obter 13,6 g (rendimento: 94 %) de 5-flúor-3-(2-
25 hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-(4-metoxifenil)-quinoxalin-2(1H)-ona na forma de um pó de cor laranja claro.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,06(2H, m), 2,43(2H, br), 2,75(2H, t), 3,88(3H, s), 6,57(1H, d), 7,01-7,10(3H, m), 7,26-7,35(3H, m), 16,19(1H, s)

[Exemplo 6]

Produção de 5-cloro-3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-(4-metoxifenil)-quinoxalin-2(1H)-ona (Composto No. II-194 da invenção (ver tabela 24))

5 6,7 g (20 mmol) de ácido 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico foi dissolvido em clorofórmio (300 mL), e a esta solução, N,N-dimetilformamida (0,5 mL) e 5,2 g (41 mmol) de cloreto de oxalila foram adicionados sequencialmente. A mistura foi agitada por uma hora a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, 10 o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi dissolvido em clorofórmio (70 mL), e esta solução foi adicionada em gotas a 0 °C por 5 minutos a uma solução preparada dissolvendo 2,5 g (22 mmol) de 1,3-cicloexanodiona e 2,5 g (25 mmol) de trietilamina em clorofórmio (70 mL). A solução de reação retornou para temperatura ambiente e foi agitada 15 por 3 horas, e então 0,86 g (10 mmol) de cianoidrina de acetona e 2,5 g (25 mmol) de trietilamina foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 12 horas a temperatura ambiente. A solução de reação foi lavada com ácido clorídrico 10 % e seca sobre sulfato de sódio anidro, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi lavado com acetato 20 de etila, para obter 6,0 g (rendimento: 70 %) de 5-cloro-3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-(4-metoxifenil)quinoxalin-2(1H)-ona na forma de um pó de cor laranja claro.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,06(2H, m), 2,44(2H, br), 2,75(2H, t), 3,88(3H, s), 6,71(1H, d), 7,09(2H, d), 7,25-7,30(3H, m), 7,39(1H, d), 16,23(1H, s)

[Exemplo 7]

Produção de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-quinoxalin-2(1H)-ona (Composto No. I-202 da invenção (ver tabela 9))

5,7 g (19 mmol) de ácido 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico e 3,1 g (24 mmol) de cloreto de oxalila foram dissolvidos em diclorometano (10 mL), e 0,026 g (0,35 mmol) de dimetilformamida foi adicionada a ele. A mistura foi aquecida a refluxo por 2 horas mantendo agitação. Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida para obter cloreto de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-

1,2-diidroquinoxalina-3-carbonila na forma de cristais amarelos (Composto No. do intermediário de produção: IX-73).

10 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

6,12 (2H, d), 6,74-6,76 (2H, m), 6,88 (1H, d), 7,01 (1H, d), 7,43 (1H, t), 7,57 (1H, t), 8,04 (1H, d)

O cloreto de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-

1,2-diidroquinoxalina-3-carbonila assim obtido foi dissolvido em diclorometano (30 mL), e a solução foi adicionada em gotas a uma mistura líquida contendo 2,7 g (24 mmol) de 1,3-cicloexanodiona, 3,7 g (36 mmol) de trietilamina e diclorometano (20 mL), em resfriamento de gelo. Depois de agitar a solução de reação por 3 horas a temperatura ambiente, 0,04 g (0,53 mmol) de cianoidrina de acetona e 3,7 g (36 mmol) de trietilamina foram adicionados à mistura líquida, e a mistura foi agitada por 12 horas a temperatura ambiente. A solução de reação foi vertida em água, e a camada aquosa foi acidificada com ácido clorídrico 10 %, e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi seca sobre sulfato de magnésio anidro, e a matéria inorgânica foi separada por filtração. O solvente foi destilado em pressão reduzida, e o resíduo assim obtido, uma solução misturada de metanol e água foi adicionada para obter um sólido. O sólido foi coletado por filtração e seco para obter 5,5 g (rendimento: 75 %) de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-quinoxalin-2(1H)-ona na forma de uma matéria amorfa amarela.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,03-2,05 (2H, m), 2,43 (2H, brs), 2,73 (2H, t), 6,08 (2H, d), 6,38-6,87 (3H, m), 6,99 (1H, d), 7,29-7,43 (2H, m), 7,88 (1H, d), 16,27 (1H, s)

5 [Exemplo 8]

Produção de 1-(2,3-diidrobenzo[b]1,4-dioxin-6-il)-3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-quinoxalin-2(1H)-ona (Composto No. I-209 da invenção (ver tabela 10))

9,9 g (31 mmol) de ácido 1-(2,3-diidrobenzo[b]1,4-dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico foi dissolvido em diclorometano (100 mL), e a esta solução, N,N-dimetilformamida (0,5 mL) e 4,7 g (37 mmol) de cloreto de oxalila foram adicionados sequencialmente. A mistura foi agitada por uma hora a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida para obter cloreto de 1-(2,3-diidrobenzo[b]1,4-dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carbonila na forma de cristais amarelos (Composto No. do intermediário de produção: IX-75).

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

4,33 (4H, s), 6,74-6,89 (3H, m), 7,08 (1H, d), 7,44 (1H, t), 7,55 (1H, t), 8,02 (1H, d)

O cloreto de 1-(2,3-diidrobenzo[b]1,4-dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carbonila assim obtido foi dissolvido em diclorometano (30 mL), e esta solução foi adicionada em gotas a 0 °C por 5 minutos a uma solução preparada dissolvendo 4,2 g (37 mmol) de 1,3-cicloexanodiona e 6,2 g (61 mmol) de trietilamina em diclorometano (30 mL). A solução de reação retornou para temperatura ambiente e foi agitada por 3 horas, e então cianidrina de acetona (1 mL) e 6,2 g (61 mmol) de trietilamina foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 12 horas a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, água (50 mL) foi adicionada à

solução de reação, a solução de reação foi ajustada para pH 12 usando uma solução aquosa 10 % de hidróxido de sódio, e a solução de reação foi separada. A camada aquosa foi ajustada para pH 1 adicionando ácido clorídrico 6 N, e então a camada aquosa foi extraída com diclorometano. A

5 camada orgânica obtida foi seca sobre sulfato de magnésio anidro, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi lavado com metanol, para obter 5,2 g (rendimento: 40 %) de 1-(2,3-diidrobenczo[b]1,4-dioxin-6-il)-3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-quinoxalin-2(1H)-ona na forma de cristais brancos leitosos.

10 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):
2,02-2,09 (2H, m), 2,44 (2H, br), 2,73-2,77 (2H, m), 4,32 (4H, s), 6,84-6,87 (3H, m), 7,04 (1H, d), 7,28-7,42 (2H, m), 7,87 (1H, d), 16,3 (1H, s)

[Exemplo 9]

15 Produção de 4-(3-flúor-4-metilfenil)-2-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-pirido[2,3-b]pirazin-3(4H)-ona (Composto No. IV-222 da invenção (ver tabela 43))

24 g (80 mmol) de ácido 4-(3-flúor-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico foi dissolvido em clorofórmio (180 mL), e N,N-dimetilformamida (1 mL) e 20 g (160 mmol) de cloreto de oxalila foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por uma hora a 40 °C. Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi dissolvido em clorofórmio (180 mL), e esta solução foi adicionada em gotas a 0 °C por 5 minutos a uma solução

25 preparada dissolvendo 10 g (90 mmol) de 1,3-cicloexanodiona e 9,0 g (90 mmol) de trietilamina em clorofórmio (180 mL). A solução de reação retornou para temperatura ambiente e foi agitada por 3 horas, e então 0,8 g (10 mmol) de cianoidrina de acetona e 9,0 g (90 mmol) de trietilamina foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 12 horas a temperatura ambiente.

Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida, e o resíduo foi extraído com acetato de etila. Uma solução aquosa 10 % de hidróxido de sódio foi adicionada, e a mistura foi ajustada para pH 12. Subsequentemente, a camada aquosa obtida foi ajustada para pH 1 adicionando ácido clorídrico 6 N, e a camada aquosa foi extraída de novo com clorofórmio. Sulfato de magnésio anidro e florisil foram adicionados à camada orgânica para secar a camada, e o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi lavado com metanol, para obter 15 g (rendimento: 48 %) de 4-(3-flúor-4-metilfenil)-2-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-pirido[2,3-b]pirazin-3(4H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,07 (2H, t), 2,35 (3H, d), 2,44 (2H, brs), 2,78 (2H, t), 7,06 (2H, d), 7,29-7,41 (2H, m), 8,18 (1H, dd), 8,48 (1H, dd), 16,06 (1H, brs)

[Exemplo 10]

Produção de 3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-(6-metil-2-piridil)-quinoxalin-2(1H)-ona (Composto No. I-173 da invenção (ver tabela 7))

(1) Produção de 3-oxo-1-cicloexenil 1-(6-metil-2-piridil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato

23,3 g de ácido 1-(6-metil-2-piridil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico foi dissolvido em clorofórmio (100 mL), e 21,0 g de cloreto de oxalila foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por uma hora a temperatura ambiente. O solvente foi destilado em pressão reduzida, e o resíduo foi dissolvido em 100 mL de clorofórmio. 10,2 g de 1,3-cicloexadiona e 10,1 g de trietilamina foram adicionados, e a mistura foi agitada por 2 horas a temperatura ambiente. A mistura de reação foi vertida em água, e extraída com clorofórmio. A camada orgânica foi lavada com salmoura saturada, e seca sobre sulfato de magnésio anidro, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida, para obter 28,8 g de 3-oxo-1-cicloexenil 1-

(6-metil-2-piridil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,12 (2H, m), 2,46 (2H, t), 2,65 (3H, s), 2,74 (2H, t), 6,11 (1H, s), 6,68 (1H, d), 7,28 (1H, d), 7,51 (3H, m), 7,93 (1H, d), 8,03 (1H, d)

5 (2) Produção de 3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-(6-metil-2-piridil)-quinoxalin-2(1H)-ona

28,8 g de 3-oxo-1-cicloexenil 1-(6-metil-2-piridil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato foi dissolvido em 100 mL de acetonitrila, e 9,3 g de trietilamina e 7,2 g de cianoidrina de acetona foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por uma hora a 80 °C. O solvente foi destilado em pressão reduzida, o resíduo foi dissolvido em clorofórmio, e a solução foi ajustada abaixo de pH 4. A camada orgânica foi lavada com salmoura saturada, e seca sobre sulfato de magnésio anidro, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida, para obter 24,2 g de 3-(2-hidróxi-6-oxo-1-cicloexenocarbonil)-1-(6-metil-2-piridil)-quinoxalin-2(1H)-ona.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,06 (m, 2H), 2,45 (t, 2H), 2,64 (s, 3H), 2,76 (t, 2H), 6,68 (s, 1H), 7,39 (m, 4H), 7,89 (m, 2H), 16,32 (s, 1H)

Os valores de propriedade dos compostos obtidos nos exemplos anteriores 1 a 10, e os compostos da presente invenção produzidos da mesma maneira que nos exemplos são apresentados na tabela 124 a tabela 134.

Tabela 124

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n _D ²⁰)
I-1	Ponto de Fusão 84-86
I-2	Ponto de Fusão 191-192
I-5	Ponto de Fusão 193-195
I-7	Ponto de Fusão 155-157
I-12	Ponto de Fusão 164-165
I-13	Ponto de Fusão 151-152
I-14	Ponto de Fusão 172-174
I- 15	Taxa Refrativa 1,6148
I-18	Ponto de Fusão 157-159
I-21	Ponto de Fusão 144- 147
I-22	Ponto de Fusão 125- 128
I-30	Ponto de Fusão 171-172
I-35	Ponto de Fusão 205-206

I-40	Ponto de Fusão	190-192
I-49	Ponto de Fusão	140-141
I-50	Ponto de Fusão	144- 145
I-57	Ponto de Fusão	201-203
I-58		Medição Incapaz
I-59	Ponto de Fusão	1.5663
I-62	Ponto de Fusão	164-166
I-65	Taxa Refrativa	1,6070
I-67	Ponto de Fusão	184-185
I-68	Ponto de Fusão	151-152
I-69	Ponto de Fusão	216-218
I-70	Ponto de Fusão	179-181
I-71	Ponto de Fusão	203-205
I-72	Ponto de Fusão	179-151
I-80	Ponto de Fusão	249-251
I-81	Ponto de Fusão	272-274
I-82	Ponto de Fusão	226-228
I-88	Ponto de Fusão	142- 144
I-90	Ponto de Fusão	153-155
I-91	Ponto de Fusão	148- 149
I-92	Ponto de Fusão	218-222
I-93		oleoso
I-94	Ponto de Fusão	186-187
I-99	Ponto de Fusão	187- 189
I-100	Ponto de Fusão	217-219
I-101	Ponto de Fusão	239-241
I-102	Ponto de Fusão	181-183
I-103	Ponto de Fusão	184-186
I-107	Ponto de Fusão	181-183
I-111	Ponto de Fusão	214-216
I-112	Ponto de Fusão	192-194
I-113	Ponto de Fusão	195-196
I-120	Ponto de Fusão	215-218
I-125	Ponto de Fusão	203-204
I-126	Ponto de Fusão	207-210
I-128	Ponto de Fusão	233-235

Tabela 125

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})
I-131	Ponto de Fusão 207-205
I-136	Ponto de Fusão 178- 143 1
I-137	Ponto de Fusão 126-127
I-139	Ponto de Fusão 159-192
I-144	Ponto de Fusão 171- 174
I-145	Ponto de Fusão 87-88
I-148	Ponto de Fusão 207-205
I-149	Ponto de Fusão 73-75
I-156	Ponto de Fusão 105-107
I-158	Ponto de Fusão 133-135
I-159	Oleoso
I-160	Ponto de Fusão 168-169
I-163	Ponto de Fusão 182-183
I-165	Ponto de Fusão 182-187
I-166	Ponto de Fusão 99-101
I-167	Ponto de Fusão 150-153
I-171	Ponto de Fusão 177-179
I-173	Ponto de Fusão 177-179
I-176	Ponto de Fusão 170-171
I-177	Ponto de Fusão 125-128
I-178	Ponto de Fusão 115-117
I-179	Ponto de Fusão 116-118
I-180	Ponto de Fusão 129-130
I-182	Ponto de Fusão 205-210
I-185	Ponto de Fusão 165-170
I-189	Ponto de Fusão 141-144
I-195	Ponto de Fusão 237-239
I-197	Ponto de Fusão 217-219
I-199	Ponto de Fusão 187-189
I-201	Ponto de Fusão 156-157
I-202	Ponto de Fusão 150-151
I-207	Ponto de Fusão 146-147
I-209	Ponto de Fusão 246-245
I-211	Ponto de Fusão 151-153
I-212	Ponto de Fusão 199-200
I-213	Ponto de Fusão 172-175
I-220	Ponto de Fusão 235-237
I-221	Ponto de Fusão 187-189
I-223	Ponto de Fusão 213-216
I-225	Ponto de Fusão 225-228
I-227	Ponto de Fusão 205-207
I-229	Ponto de Fusão 162-163
I-230	Ponto de Fusão 161-164
I-238	Ponto de Fusão 179-151
I-241	Ponto de Fusão 161-164
I-243	Ponto de Fusão 170-171
I-245	Ponto de Fusão 229-231
I-247	Ponto de Fusão 233-235
I-249	Ponto de Fusão 225-226
I-250	Ponto de Fusão 195- 197
I-256	Ponto de Fusão 300 ou mais
I-263	Ponto de Fusão 145- 150

Tabela 126

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})	
I-264	Ponto de Fusão	170-173
I-265	Ponto de Fusão	193-195
I-266	Ponto de Fusão	199-200
I-267	Ponto de Fusão	163-166
I-268	Ponto de Fusão	127-129
I-269	Ponto de Fusão	211-213
I-270	Ponto de Fusão	107-169
I-271	Ponto de Fusão	138-140
I-272	Ponto de Fusão	173-174
I-273	Ponto de Fusão	141-143
I-274	Ponto de Fusão	148-150
I-275	Ponto de Fusão	204-205
I-276		Medição Incapaz
I-277	Ponto de Fusão	135-137
I-278	Ponto de Fusão	144-145
I-279	Ponto de Fusão	166-168
I-280	Ponto de Fusão	186-186
I-281	Ponto de Fusão	139-141
I-282	Ponto de Fusão	164-165
I-283	Ponto de Fusão	190-192
I-284	Ponto de Fusão	160-162
I-363	Ponto de Fusão	250-252
I-364	Ponto de Fusão	168-170
I-365	Ponto de Fusão	182-183
I-366	Ponto de Fusão	212-214
I-367	Ponto de Fusão	208-210
I-368	Ponto de Fusão	152-154
I-371	Ponto de Fusão	189-190
I-372	Ponto de Fusão	205-207
I-373	Ponto de Fusão	124-126
I-379	Ponto de Fusão	208-209
I-380	Ponto de Fusão	146-147
I-3S5	Ponto de Fusão	194-196
I-388	Ponto de Fusão	172-175
I-395	Ponto de Fusão	140-142

Tabela 127

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})
II-1	Ponto de Fusão 68-71
II-4	Ponto de Fusão 203-204
II-5	Ponto de Fusão 180-182
II-6	Ponto de Fusão 172-174
II-7	Ponto de Fusão 177-178
II-8	Ponto de Fusão 70-72
II-9	Ponto de Fusão 100-101
II-11	Ponto de Fusão 202-204
II-13	Ponto de Fusão 201-202
II-14	Ponto de Fusão 105-107
II-15	Ponto de Fusão 176-179
II-20	Ponto de Fusão 93-94
II-21	Ponto de Fusão 123-126
II-23	Ponto de Fusão 136-138
II-24	Ponto de Fusão 101-104
II-29	Ponto de Fusão 169-171
II-33	Ponto de Fusão 147-149
II-39	Ponto de Fusão 125-127
II-44	Ponto de Fusão 112-114
II-51	Ponto de Fusão 264-266
II-52	Ponto de Fusão 201-202
II-57	Ponto de Fusão 124-125
II-62	Ponto de Fusão 112-114
II-63	Ponto de Fusão 175-177
II-64	Ponto de Fusão 174-176
II-68	Ponto de Fusão 164-167
II-69	Ponto de Fusão 85-90
II-71	Ponto de Fusão 78-80
II-74	Ponto de Fusão 106-108
II-75	Ponto de Fusão 173-175
II-81	Ponto de Fusão 135-136
II-84	Ponto de Fusão 149-150
II-90	Ponto de Fusão 103-105
II-95	Ponto de Fusão 111-113
II-101	Ponto de Fusão 61-64
II-116	Ponto de Fusão 93-96
II-121	Ponto de Fusão 125-128
II-122	Ponto de Fusão 172-174
II-124	Ponto de Fusão 91-94
II-125	Ponto de Fusão 274-277
II-129	Ponto de Fusão 230-232
II-130	Ponto de Fusão 96-99
II-131	Ponto de Fusão 136-137
II-136	Ponto de Fusão 143-146
II-137	Ponto de Fusão 107-110

Tabela 128

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})	
II-140	Ponto de Fusão	128-130
II-146	Ponto de Fusão	111-113
II- 149	Ponto de Fusão	101- 103
II- 167	Ponto de Fusão	108-110
II-168	Ponto de Fusão	122-123
II-169	Ponto de Fusão	215-216
II- 173	Ponto de Fusão	185- 18S
II- 174	Ponto de Fusão	98-101
II-175	Ponto de Fusão	110-112
II-177	Ponto de Fusão	136-138
II-178	Ponto de Fusão	113-115
II-179	Ponto de Fusão	190-193
II-180	Ponto de Fusão	106-109
II-185	Ponto de Fusão	124-126
II-186	Ponto de Fusão	242-245
II- 187	Ponto de Fusão	114-116
II-188	Ponto de Fusão	136-138
II-189	Ponto de Fusão	187-189
II-190	Ponto de Fusão	217-219
II- 193	Ponto de Fusão	173-175
II-194	Ponto de Fusão	105-107
II- 195	Ponto de Fusão	191-193
II-196	Ponto de Fusão	120-122
II-197	Ponto de Fusão	205-207
II-205	Ponto de Fusão	139-142
II-208	Ponto de Fusão	102-104
II-209	Ponto de Fusão	109-111
II-210	Ponto de Fusão	98-100
II-211	Ponto de Fusão	113-115
II-212	Ponto de Fusão	126-129
II-213	Ponto de Fusão	171-172
II-214	Ponto de Fusão	97-99
II-215	Ponto de Fusão	116-117
II-216	Ponto de Fusão	181-183
II-217	Ponto de Fusão	197-199
II-218	Ponto de Fusão	138-140
II-219	Ponto de Fusão	183-185
II-220	Ponto de Fusão	128-130
II-221	Ponto de Fusão	106-109
II-222	Ponto de Fusão	91-92
II-223	Ponto de Fusão	110-111
II-224	Ponto de Fusão	143-145
II-225	Ponto de Fusão	135-138
II-226	Ponto de Fusão	141-143
II-227	Ponto de Fusão	201-203
II-228	Ponto de Fusão	182-185
II-229	Ponto de Fusão	145-148

Tabela 129

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})
II-230	Ponto de Fusão 161-163
II-231	Ponto de Fusão 154-157
II-232	Ponto de Fusão 205-208
II-233	Ponto de Fusão 212-214
II-234	Ponto de Fusão 118-121
II-235	Ponto de Fusão 97-98
II-236	Ponto de Fusão 232-234
II-237	Ponto de Fusão 182-183
II-238	Ponto de Fusão 213-216
II-239	Ponto de Fusão 153-155
II-240	Ponto de Fusão 135-137
II-241	Ponto de Fusão 121-123
II-242	Ponto de Fusão 145-146
II-243	Ponto de Fusão 176-179
II-244	Ponto de Fusão 257-260
II-245	Ponto de Fusão 165-166
II-246	Ponto de Fusão 155-158
II-247	Ponto de Fusão 201-204
II-248	Ponto de Fusão 113-116
II-249	Ponto de Fusão 165-167
II-250	Ponto de Fusão 197-198
II-251	Ponto de Fusão 129-131
II-252	Ponto de Fusão 162-164
II-253	Ponto de Fusão 202-204
II-254	Ponto de Fusão 104-106
II-255	Ponto de Fusão 118-120
II-256	Ponto de Fusão 189-190
II-257	Ponto de Fusão 91-92
II-258	Ponto de Fusão 195-197
II-259	Ponto de Fusão 214-216
II-260	Ponto de Fusão 224-226
II-261	Ponto de Fusão 181-183
II-262	Ponto de Fusão 264-267
II-263	Ponto de Fusão 194-196
II-301	Ponto de Fusão 222-223
II-302	Ponto de Fusão 190
II-303	Ponto de Fusão 102-103
II-304	Ponto de Fusão 183-185
II-305	Ponto de Fusão 93-95
II-306	Ponto de Fusão 156-157
II-307	Ponto de Fusão 227-229
II-317	Ponto de Fusão 107-109
II-323	Ponto de Fusão 106-108

Tabela 130

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})
III-2	Ponto de Fusão 177-180
III-5	Ponto de Fusão 101-103
III-7	Ponto de Fusão 105-106
III-12	Taxa Refrativa 1,5852
III-13	Ponto de Fusão 124-126
III-15	Taxa Refrativa 1,5521
III-30	Ponto de Fusão 128-130
III-35	Ponto de Fusão 198-200
III-40	Ponto de Fusão 163- 165
III-45	Ponto de Fusão 141- 142
III-59	Ponto de Fusão 87-88
III-70	Ponto de Fusão 158-159
III-SS	Ponto de Fusão 119-121
III-90	Ponto de Fusão 126- 128
III-96	Ponto de Fusão 132-134
III-99	Ponto de Fusão 142-144
III-107	Ponto de Fusão 178- 180
III-108	Ponto de Fusão 155-157
III-111	Ponto de Fusão 170-172
III-117	Ponto de Fusão 185-188
III-118	Ponto de Fusão 149-151
III-120	Ponto de Fusão 167-16S
III-130	Ponto de Fusão 1S4-185
III-139	Ponto de Fusão 226-229
III-15S	Ponto de Fusão 185-187
III-173	Ponto de Fusão 202-204
III- 189	Ponto de Fusão 196- 198
III-201	Ponto de Fusão 135-13S
III-202	Ponto de Fusão 197-199
III-207	Ponto de Fusão 201-203
III-209	Ponto de Fusão 231-233
III -212	Ponto de Fusão 93-96
III-213	Ponto de Fusão 139-141
III-220	Ponto de Fusão 148-151
III-221	Ponto de Fusão 182-185
III-229	Ponto de Fusão 87-88
III-230	Ponto de Fusão 113-115
III-231	Ponto de Fusão 143-144
III-232	Ponto de Fusão 108-110
III-233	Ponto de Fusão S3-S5
III-234	Ponto de Fusão 168- 170
III-235	Ponto de Fusão 136- 138
III-236	Ponto de Fusão 168-171
III-237	Ponto de Fusão 128- 130
III-23S	Ponto de Fusão 136-137
III-239	Ponto de Fusão 122- 124
III-240	Ponto de Fusão 222-224

Tabela 131

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})	
III-241	Ponto de Fusão	159-160
III-242	Ponto de Fusão	71-73
III-243	Ponto de Fusão	88-89
III-244	Ponto de Fusão	178-180
III-245	Ponto de Fusão	161-162
III-246	Ponto de Fusão	129-131
III-247	Ponto de Fusão	133-134

Tabela 132

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})	
IV-1	Ponto de Fusão	253-255
IV-2	Ponto de Fusão	158-159
IV-3	Ponto de Fusão	216-218
IV-4	Ponto de Fusão	224-226
IV-6	Ponto de Fusão	216-217
IV-7	Ponto de Fusão	231-232
IV-8	Ponto de Fusão	231-232
IV-9	Ponto de Fusão	181-183
IV-11	Ponto de Fusão	224-227
IV-13	Ponto de Fusão	203-206
IV-17	Ponto de Fusão	264-266
IV-18	Ponto de Fusão	237-239
IV-19	Ponto de Fusão	251-253
IV-20	Ponto de Fusão	163-165
IV-21	Ponto de Fusão	203-205
IV-23	Ponto de Fusão	110- 112
IV-24	Ponto de Fusão	117-119
IV-30	Ponto de Fusão	123-125
IV-33	Ponto de Fusão	198-199
IV-34	Ponto de Fusão	183-185
IV-39	Ponto de Fusão	168-171
IV-40	Ponto de Fusão	176-178
IV-41	Ponto de Fusão	203-205
IV-44	Ponto de Fusão	94-96
IV-52	Ponto de Fusão	171-172
IV-57	Ponto de Fusão	177-180
IV-62	Ponto de Fusão	133-135
IV-68		Medição Incapaz
IV-G9	Ponto de Fusão	102-104
IV-85	Ponto de Fusão	185-186
IV-90	Ponto de Fusão	172-174
IV-95	Ponto de Fusão	133-136
IV-100	Ponto de Fusão	100-102
IV-101	Ponto de Fusão	155-156
IV-106	Ponto de Fusão	166-169
IV-128	Ponto de Fusão	176-178
IV-136	Ponto de Fusão	196-197
IV-150	Ponto de Fusão	201-202
IV-151	Ponto de Fusão	177-178
IV- 152	Ponto de Fusão	230-232
IV-153	Ponto de Fusão	242-245
IV-154	Ponto de Fusão	226-228
IV-155	Ponto de Fusão	260-261
IV-156	Ponto de Fusão	215-217
IV-157	Ponto de Fusão	121-124

Tabela 133

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})
IV- 155	Ponto de Fusão 251-253
IV-159	Ponto de Fusão 183-185
IV- 160	Ponto de Fusão 208-211
IV- 161	Ponto de Fusão 237-240
IV-165	Ponto de Fusão 228-231
IV-166	Ponto de Fusão 196-199
IV-168	Ponto de Fusão 199-201
IV- 169	Ponto de Fusão 171-173
IV- 170	Ponto de Fusão 216-217
IV- 173	Ponto de Fusão 208-210
IV- 174	Ponto de Fusão 196-197
IV- 177	Ponto de Fusão 204-207
IV- 178	Ponto de Fusão 167-169
IV-179	Ponto de Fusão 153-155
IV-180	Ponto de Fusão 177-179
IV-1S4	Ponto de Fusão 181-182
IV-185	Ponto de Fusão 104-106
IV-186	Ponto de Fusão 221-223
IV- 187	Ponto de Fusão 214-2 16
IV- 188	Ponto de Fusão 217-219
IV- 189	Ponto de Fusão 194-196
IV- 191	Ponto de Fusão 118-120
IV-200	Ponto de Fusão 237-239
IV-201	Ponto de Fusão 167-165
IV-202	Ponto de Fusão 155-157
IV-203	Ponto de Fusão 189-191
IV-206	Ponto de Fusão 122-125
IV-208	Ponto de Fusão 171-172
IV-209	Ponto de Fusão 242-245
IV-210	Ponto de Fusão 222-224
IV-211	Medição Incapaz
IV-212	Ponto de Fusão 205-210
IV-213	Ponto de Fusão 177-179
IV-214	Ponto de Fusão 219-222
IV-215	Ponto de Fusão 176-175
IV-216	Ponto de Fusão 118-122
IV-217	Ponto de Fusão 231-232
IV-218	Ponto de Fusão 180-182
IV-219	Ponto de Fusão 200-202
IV-220	Ponto de Fusão 225-228
IV-221	Ponto de Fusão 185-187
IV-222	Ponto de Fusão 185-186
IV-223	Ponto de Fusão 210-212
IV-224	Ponto de Fusão 254-257
IV-225	Ponto de Fusão 167-169
IV-226	Ponto de Fusão 186-189
IV-227	Ponto de Fusão 200-202
IV-228	Ponto de Fusão 182-184
IV-229	Ponto de Fusão 177-178
IV-230	Ponto de Fusão 142-144

Tabela 134

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})	
IV-231	Ponto de Fusão	262-265
IV-232	Ponto de Fusão	181-153
IV-233	Ponto de Fusão	200-203
IV-234	Ponto de Fusão	125-127
IV-245	Ponto de Fusão	88-89
IV-236	Ponto de Fusão	170-172
IV-237	Ponto de Fusão	179-182
IV-238	Ponto de Fusão	146-149
IV-239	Ponto de Fusão	207-209
IV-240	Ponto de Fusão	135-137
IV-241	Ponto de Fusão	208-211
IV-242	Ponto de Fusão	137-139
IV-243	Ponto de Fusão	128- 130
IV-244	Ponto de Fusão	181-152
IV-245	Ponto de Fusão	92-94
IV-246	Ponto de Fusão	198-201
IV-247	Ponto de Fusão	98- 100
IV-248	Ponto de Fusão	122-124
IV-249	Ponto de Fusão	104- 107
IV-250	Ponto de Fusão	119- 122
IV-251	Ponto de Fusão	184- 187
IV-252	Ponto de Fusão	119-121
IV-253	Ponto de Fusão	204-2045
IV-254	Ponto de Fusão	233-235
IV-255	Ponto de Fusão	247-249
IV-256	Ponto de Fusão	230-232
IV-257	Ponto de Fusão	234-236
IV-258	Ponto de Fusão	191-192
IV-259	Ponto de Fusão	228-229
IV-260	Ponto de Fusão	202-204
IV-261	Ponto de Fusão	126- 128
IV-262	Ponto de Fusão	235-237
IV-263	Ponto de Fusão	216-218
IV-264	Ponto de Fusão	197- 199
IV-265	Ponto de Fusão	266-268
IV-266	Ponto de Fusão	210-211
IV-267	Ponto de Fusão	208-210
IV-268	Ponto de Fusão	217-219
IV-269	Ponto de Fusão	207-210
IV-270	Ponto de Fusão	217-220
IV-271	Ponto de Fusão	74-76
IV-273	Ponto de Fusão	268-271
IV-274	Ponto de Fusão	196-199
IV-284	Ponto de Fusão	181-183
IV-285	Ponto de Fusão	100- 103
IV-286	Ponto de Fusão	103- 105
IV-287	Ponto de Fusão	217-219

[Dados de RMN]

Para os composto Nos. I-15, I-58, I-65, I-93, I-159, I-276, III-12, III-15 e IV-211, os dados de RMN-¹H (valor CDCl₃/TMS δ (ppm)) são apresentados a seguir.

- 5 Composto No. I-15:
1,02(3H, t), 1,55(2H, m), 1,81(2H, m), 2,07(2H, t), 2,44(2H, s), 2,77(2H, t), 4,27(2H, t), 7,36(2H, m), 7,58(1H, t), 7,86(1H, d), 16,32(1H, s)
- 10 Composto No. I-58:
2,07(2H, s), 2,42(2H,s), 2,77(2H,t), 3,34(3H, s), 3,51(2H, s), 3,78(2H, s), 5,79(2H, s), 7,35(1H, t), 7,64(2H, m), 7,83(1H, d), 16,27(1H, s)
- 15 Composto No. I-65:
1,42-2,09 (4H, m), 2,07 (2H, s), 2,43 (2H, s), 3,01 (2H, s), 3,59-4,05 (5H, m), 5,75 (1H, d), 5,85 (1H, d), 7,36 (1H, t), 7,54-7,65 (2H, m), 7,82 (1H, d), 16,3 (1H, br)
- 20 Composto No. I-68:
1,41 (3H, t), 2,07 (2H, s), 2,44 (2H, s), 2,77 (2H, t), 4,04 (2H, q), 6,87 (1H, m), 7,02 (1H, d), 7,31 (1H, m), 7,46 (1H, t), 8,18 (1H, d), 8,49 (1H, d), 1,48 (3H, t), 4,13 (2H, q), 7,15 (2H, d), 7,23 (2H, d), 7,56 (1H, m), 8,63 (1H, d), 8,72 (1H, d)
- 25 Composto No. I-93:
2,00-2,08(4H, m), 2,43(2H, br), 2,77(2H, t), 3,36(3H, s), 3,47(2H, t), 4,36(2H, t), 7,34(1H, t), 7,50(1H, d), 7,57(1H, t), 7,86(1H, d), 16,33(1H, br).
- Composto No. I-159:
2,07(2H, t), 2,46(2H, br), 2,78(2H, t), 7,25(1H, s), 7,36(1H, t), 7,46(1H, t), 7,61(1H, d), 7,87(1H, d), 7,89(1H, d), 16,23(1H, br).
- Composto No. I-276:
2,04(2H, m), 2,42(2H, m), 2,53(2H, m), 3,84(3H, s), 6,52-

6,60(2H, m), 7,06-7,59(6H, m), 7,86(1H, d), 18,1(1H, s)

Composto No. III-12:

1,06 (3H, s), 1,83 (2H, m), 2,08 (2H, t), 2,44 (2H, s), 2,65 (2H, s), 4,41 (2H, t), 7,27 (1H, d), 8,13 (1H, d), 8,61 (1H, d), 16,13 (1H, s)

5 Composto No. III-15:

1,01 (3H, s), 1,52 (2H, m), 1,79 (2H, m), 2,05 (2H, t), 2,45 (2H, s), 2,76 (2H, t), 4,47 (2H, t), 7,28 (1H, d), 8,13 (1H, d), 8,61 (1H, d), 16,16 (1H, s)

Composto No. IV-211:

10 2,06(2H, t), 2,45(2H, brs), 2,78(2H, brs), 3,73(6H, s), 6,72(2H, d), 7,25(1H, d), 7,42(1H, t), 8,16(1H, dd), 8,46(1H, dd), 16,11(1H, brs)

[Exemplo de referência 1]

(Intermediário de produção) Produção de ácido 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

15 (Composto No. do intermediário de produção: V-2)

(1) Produção de 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

4,0 g (18,3 mmol) de 2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila foi dissolvido em N,N-dimetilformamida (100 mL), e em
 20 uma corrente de nitrogênio, 0,81 g (20,3 mmol) de 60 % de hidreto de sódio (oleoso) foi adicionado a ele, mantendo ao mesmo tempo a temperatura do líquido na faixa de 5 °C a 10 °C. Depois da agitação da mistura por uma hora a temperatura ambiente, 3,9 g (27,5 mmol) de iodometano foram adicionados em gotas à solução de reação. A mistura foi agitada por um dia a temperatura
 25 ambiente, e então a mistura de reação foi vertida em água, e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, e seca sobre sulfato de sódio anidro. A matéria inorgânica foi separada por filtração, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia

em gel de sílica (solvente de desenvolvimento: acetato de etila:hexano = 3:2), para obter 3,0 g (rendimento: 71 %) de 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um pó branco.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

5 1,45(3H,t), 3,74(3H,s), 4,51(2H,q), 7,35-7,43(2H,m),
7,67(1H,t), 7,96(1H,d)

(2) Produção de ácido 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

3,0 g (12,9 mmol) de 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila foi dissolvido em etanol (100 mL), e 4,1 g (25,6 mmol) de uma solução aquosa 25 % de hidróxido de sódio foram adicionados em gotas a ele a temperatura ambiente. A mistura foi agitada por um dia a temperatura ambiente, e então a mistura de reação foi concentrada em pressão reduzida. Água foi adicionada à mistura de reação, e a solution foi acidificada usando
15 ácido clorídrico 10 %, e extraída com clorofórmio. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de sódio anidro, e então a matéria inorgânica foi separada por filtração. Então, o solvente foi destilado em pressão reduzida, para obter 2,6 g (rendimento: 99 %) de ácido 1-metil-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico na forma de um pó amarelo leitoso.

20 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,89(3H,s), 7,52(1H,d), 7,58(1H,t), 7,86(1H,t), 8,28(1H,d),
14,23(1H,br)

[Exemplo de referência 2]

(Intermediário de produção) Produção de ácido 3-oxo-4-fenil-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico (Composto No. do intermediário de produção: VIII-1)

(1) Produção de 3-oxo-4-fenil-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato de etila

11,68 g (63 mmol) de 3-amino-2-anilinopiridina foram

dissolvidos em etanol (150 mL), e 12,07 g (69 mmol) de cetomalonato de dietila foram adicionados nele. A mistura foi aquecida a refluxo por 4 horas mantendo agitação. Depois de confirmar que a reação foi completa, a solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o solvente foi destilado em
 5 pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi lavado usando éter diisopropílico, para obter 10,74 g (rendimento: 58 %) de 3-oxo-4-fenil-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato de etila na forma de cristais amarelo claro.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

10 1,44(3H, t), 4,51(2H, q), 7,30(2H, d), 7,35(1H, q), 7,56(3H, m), 8,30(1H, q), 8,52(1H, q)

(2) Produção de ácido 3-oxo-4-fenil-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico

10,74 g (36 mmol) de 3-oxo-4-fenil-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato de etila foi dissolvido em ácido acético (270 mL), e
 15 ácido clorídrico 6 N (80 mL) foi adicionado a este a temperatura ambiente. Então, a mistura foi agitada durante toda a noite a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida, e água (100 mL) foi adicionada. O sólido assim obtido foi
 20 separado por filtração e seco, para obter 6,50 g (rendimento: 67 %) de ácido 3-oxo-4-fenil-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico na forma de cristais marrom claro.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

25 7,33(2H, d), 7,57(1H, m), 7,65(3H, m), 8,64(1H, q), 8,70(1H, q)

[Exemplo de referência 3]

(Intermediário de produção) Produção de ácido 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico (Composto No. do intermediário de produção: VIII-34)

(1) Produção de N-(4-metoxifenil)-3-nitropiridin-2-amina

5,0 g (32 mmol) de 2-cloro-3-nitropiridina foi dissolvido em 2-etoxietanol (150 mL), e água (150 mL) foi adicionada a ele. À solução misturada, 3,9 g (32 mmol) de 4-metoxianilina e ácido clorídrico 6 N (1 mL) foram adicionados, e a mistura foi aquecida a refluxo por 12 horas mantendo agitação. Depois de confirmar que a reação foi completa, a solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo foi extraído com acetato de etila, e lavado com salmoura saturada, e então a camada orgânica obtida foi seca sobre sulfato de magnésio anidro. A matéria inorgânica foi separada por filtração, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida, para obter 6,6 g (rendimento: 85 %) de N-(4-metoxifenil)-3-nitropiridin-2-amina na forma de cristais de cor laranja.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,83(3H, s), 6,78(1H, q), 6,94(2H, d), 7,49(2H, d), 8,44(1H, q), 8,51(1H, q), 9,96(1H, brs)

(2) Produção de 3-amino-2-(4-metoxifenil)aminopiridina

6,6 g (27 mmol) de 2-(4-metoxifenil)amino-3-nitropiridina foi dissolvido em metanol (150 mL). Uma solução em que cloreto de estanho (II) diidratado foi dissolvido em ácido clorídrico 12 N (40 mL) foi preparada, e esta solução foi adicionada em gotas à solução de reação a 0 °C por 5 minutos. A solução de reação retornou para temperatura ambiente e então foi agitada por 3 horas. Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida, e água (100 mL) foi adicionado. A solução de reação foi ajustada para pH 12 usando uma solução aquosa 10 % de hidróxido de sódio, subsequentemente filtrada e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi seca sobre sulfato de magnésio anidro, e então a matéria inorgânica foi separada por filtração. O solvente foi destilado em pressão reduzida, para obter 5,2 g (rendimento: 90 %) de 3-amino-2-(4-metoxifenil)aminopiridina na forma de cristais de cor laranja.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,34(2H, s), 3,79(3H, s), 6,06(1H, brs), 6,69(1H, q), 6,87(2H, d), 6,97(1H, q), 7,22(2H, d), 7,80(1H, q)

(3) Produção de 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato de etila

5,2 g (24 mmol) de 3-amino-2-(4-metoxifenil)aminopiridina foi dissolvido em etanol (150 mL), e 4,6 g (27 mmol) de cetomalonato de dietila foram adicionados a ele. A mistura foi aquecida a refluxo por 9 horas mantendo agitação. Depois de confirmar que a reação foi completa, a solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia em coluna (solvente de desenvolvimento: acetato de etila:hexano = 1:2), para obter 2,9 g (rendimento: 37 %) de 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato de etila na forma de cristais amarelos.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,44(3H, t), 3,88(2H, s), 4,51(2H, q), 7,09(2H, d), 7,22(2H, d), 7,35(1H, q), 8,29(1H, q), 8,54(1H, q)

(4) Produção de ácido 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico

2,9 g (9 mmol) de 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato de etila foi dissolvido em 1,4-dioxano (30 mL). Uma solução em que 1,8 g (13 mmol) de carbonato de potássio foi dissolvido em água (60 mL) foi preparada, e foi adicionado à solução de reação a temperatura ambiente, e então a mistura foi agitada por uma hora a 50 °C. Depois de confirmar que a reação foi completa, a solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o solvente foi destilado em pressão reduzida. Água (50 mL) foi adicionada, e então a solução de reação foi resfriada a 0 °C, e ajustada para pH 1 usando ácido clorídrico 6 N.

Subsequentemente, um sólido foi separado por filtração e seco, para obter 2,6 g (rendimento: 98 %) de ácido 4-(4-metoxifenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico na forma de cristais amarelos.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

5 3,91(3H, s), 7,15(2H, d), 7,23(2H, d), 7,56(1H, q), 8,63(1H, q), 8,72(1H, q)

[Exemplo de referência 4]

(Intermediário de produção) Produção de 1-(3-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

10 2,0 g (9,2 mmol) de etil 2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato foi dissolvido em diclorometano (100 mL), e 2,8 g (1,8 mmol) de ácido 3-metoxifenilbórico, 3,3 g (1,8 mmol) de acetato de cobre (II) anidro e 1,4 g (1,8 mmol) de piridina foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 72 horas a temperatura ambiente. Após o término da reação, a matéria

15 inorgânica foi separada por filtração, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia em coluna (solvente de desenvolvimento: acetato de etila:hexano = 1:1), para obter 1,2 g (rendimento: 42 %) de 1-(3-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um pó branco.

20 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,43(3H, t), 3,83(3H, s), 4,51(2H, q), 6,77-6,88(2H, m), 7,08(2H, d), 7,35(1H, t), 7,39-7,53(2H, m), 7,98(1H, d)

[Exemplo de referência 5]

(Intermediário de produção) Produção de ácido 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

(Composto No. do intermediário de produção: V-103)

(1) Produção de 2-oxo-1-(2-propinil)-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

9,2 g (62,9 mmol) de N-(2-propinil) 1,2-fenilenediamina e

12,1 g (69,2 mmol) de cetomalonato de dietila foram dissolvidos em tolueno (100 mL), e a solução foi refluxada por 3 horas. Depois de confirmar que a reação foi completa, a solução de reação foi concentrada em pressão reduzida, e o material sólido assim obtido foi lavado com éter diisopropílico, para obter
 5 15,0 g (rendimento: 93 %) de 2-oxo-1-(2-propinil)-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um pó branco.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,45(3H,t), 2,32(1H,t), 4,51(2H,q), 5,08(2H,d), 7,43(1H,t),
 7,52(1H,d), 7,70(1H,t), 7,97(1H,d)

10 (2) Produção de cloroacetaldoxima

10,4 g (77,9 mmol) de N-clorosuccinimida foi dissolvido em N,N-dimetilformamida (65 mL), e 3,6 g (60,9 mmol) de acetaldoxima foi adicionada em gotas a uma temperatura na faixa de 0 °C a 5 °C. A mistura foi agitada por 3 horas a 10 °C. Água foi adicionada à solução de reação, e a
 15 mistura foi então extraída com éter dietílico. A camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca e concentrada, para obter cloroacetaldoxima na forma de um líquido amarelo. A cloroacetaldoxima obtida foi usada na reação subsequente sem purificação.

20 (3) Produção de 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

3,0 g (11,7 mmol) de 2-oxo-1-(2-propinil)-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila e 3,28 g (35,1 mmol) de cloroacetaldoxima foram dissolvidos em tetraidrofurano (30 mL), e 3,55 g (35,1 mmol) de trietilamina foi adicionada em gotas a uma temperatura na
 25 faixa de 0 °C a 5 °C. A mistura foi agitada por 3 dias a temperatura ambiente. Depois de confirmar que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida, e o resíduo foi extraído com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa de ácido cítrico, seca sobre sulfato de sódio anidro, e concentrada. O material sólido assim obtido foi

lavado com éter diisopropílico, para obter 3,4 g (rendimento: 93 %) de 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um pó branco.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

5 1,45(3H,t), 2,25(3H,s), 4,52(2H,q), 5,52(2H,s), 6,14(1H,s),
7,42(1H,t), 7,52(1H,d), 7,68(1H,t), 7,98(1H,d)

(4) Produção de ácido 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

3,0 g (9,58 mmol) de 1-[(3-metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-
10 1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila e 0,46 g (11,5 mmol) de
hidróxido de lítio monoidratado foram dissolvidos em uma mistura de
solventes de etanol (30 mL) e água (30 mL), e a solução foi agitada por 2
horas a temperatura ambiente. A solução de reação foi concentrada a metade
do volume original, e água foi adicionada ao resíduo. A mistura foi
15 acidificada usando ácido clorídrico 10 %, e então extraída com acetato de
etila. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio
anidro, e concentrada para obter 2,3 g (rendimento: 84 %) de ácido 1-[(3-
metilisoxazol-5-il)metil]-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico na forma
de um pó branco.

20 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,28 (3H,s) , 5,66(2H,s), 7,62(1H,t), 7,71(1H,d), 7,87(1H,t),
8,28(1H,d)

[Exemplo de referência 6]

Produção de ácido 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoretóxi)metil]-1,2-
25 diidroquinoxalina-3-carboxílico (Composto No. do intermediário de
produção: V-35)

(1) Produção de 1-(metiltiometil)-2-oxo-1,2-
diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

5,0 g (22,9 mmol) de 2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-

carboxilato de etila, 3,8 g (27,5 mmol) de carbonato de potássio, 4,56 g (27,5 mmol) de iodeto de potássio e 2,43 g (25,2 mmol) de sulfeto de clorometil metila foram dissolvidos em acetona (100 mL), e a solução foi refluxada por 5 horas. Depois que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida, e ao resíduo assim obtido, uma mistura de água e acetato de etila foi adicionada. A mistura resultante foi separada. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro, e a matéria inorgânica foi separada por filtração. O solvente foi destilado em pressão reduzida, e o resíduo assim obtido foi solidificado usando éter dietílico, para obter 3,5 g (rendimento: 55 %) de 1-(metiltiometil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um pó branco.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,44(3H,t), 2,32(3H,s), 4,51(2H,q), 5,39(2H,s), 7,40(2H,m), 7,67(1H,t), 7,98(1H,d)

(2) Produção de 1-(clorometil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

2,1 g (7,5 mmol) de 1-(metiltiometil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila foi dissolvido em diclorometano (10 mL), e 1,3 g (9,8 mmol) de cloreto de sulfurila foi adicionado em gotas a 10 °C ou abaixo disso. A mistura foi agitada por 2 horas a temperatura ambiente. Depois que a reação foi completa, o solvente foi destilado em pressão reduzida, para obter 1-(clorometil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila. O produto de clorometilação assim obtido foi usado na reação subsequente sem purificação.

(3) Produção de 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoretóxi)metil]-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

1,2 g (9,0 mmol) de 2,2,2,-trifluoretanol foi dissolvido em N,N-dimetilformamida (20 mL), e 0,36 g (9,0 mmol) de 60 % de hidreto de sódio (oleoso) foi adicionado em pequenas porções. A mistura foi agitada por

uma hora a temperatura ambiente. A esta de reação, o 1-(clorometil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila previamente obtido foi adicionado a 10 °C ou abaixo. A mistura foi agitada por 3 horas a temperatura ambiente, e então vertida em água gelada, e um material sólido precipitado dele foi coletado por filtração. O material sólido assim obtido foi lavado com água, e então seco em pressão reduzida, para obter 2,0 g (rendimento: 81 %) de 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoretóxi)metil]-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um pó amarelo.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,45(3H,t), 4,10 (2H,q) , 4,52 (2H,q) , 5,85(2H,s), 7,45(1H,t), 7,54(1H,d), 7,68(1H,t), 7,97(1H,d)

(4) Produção de ácido 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoretóxi)metil]-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

1,5 g (4,54 mmol) de 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoretóxi)metil]-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila e 0,28 g (6,81 mmol) de hidróxido de lítio monoidratado foram dissolvidos em um mistura de solventes de etanol (30 mL) e água (30 mL), e a solução foi agitada por 2 horas a temperatura ambiente. A solução de reação foi concentrada a metade do volume original, e então água foi adicionada ao resíduo. A mistura foi acidificada usando ácido clorídrico 10 %, e então extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio anidro, e concentrada para obter 2,4 g (rendimento: 53 %) de ácido 2-oxo-1-[(2,2,2-trifluoretóxi)metil]-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico na forma de um pó branco.

4,14 (2H,q) , 5,98(2H,s), 7,64(2H,m), 7,86(1H,t), 8,26(1H,d)

[Exemplo de referência 7]

Produção de ácido 5-flúor-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico (Composto No. do intermediário de produção: VI-134)

(1) Produção de 3-flúor-N-(4-metoxifenil)-2-nitroanilina

20,0 g (126 mmol) de 2,6-difluornitrobenzeno e 17,0 g (138 mmol) de p-anisidina foram dissolvidos em N,N-dimetilformamida (60 mL), e 20,8 g (150 mmol) de carbonato de potássio foi adicionado a ele. A mistura foi aquecida com agitação por 12 horas a 75 °C. A mistura de reação foi
 5 vertida em água, e extraída com acetato de etila. A camada orgânica extraída foi lavada com água, ácido clorídrico 10 %, água, e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio nesta maneira, seca sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia em gel de sílica (solvente de desenvolvimento:
 10 acetato de etila:hexano = 1:9), para obter 21,2 g (rendimento: 64 %) de 3-flúor-N-(4-metoxifenil)-2-nitroanilina na forma de um líquido marrom.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,84(s,3H), 6,50(t,1H), 6,73(d,1H), 6,94(d,2H), 7,15-7,21(m,3H), 8,51(br,1H)

15 (2) Produção de 3-flúor-N1-(4-metoxifenil)-1,2-fenilenediamina

21,2 g (80,8 mmol) de 3-flúor-N-(4-metoxifenil)-2-nitroanilina foi dissolvido em etanol (600 mL), e 2,1 g de carbono ativado em paládio 5 % foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 12 horas em uma atmosfera
 20 de hidrogênio. A mistura de reação foi filtrada, e o filtrado foi concentrado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia em gel de sílica (solvente de desenvolvimento: acetato de etila:hexano = 1:4), para obter 15,4 g (rendimento 82 %) de 3-flúor-N1-(4-metoxifenil)-1,2-fenilenodiamina na forma de um líquido amarelo claro.

25 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,63(br,2H), 3,78(s,3H), 5,12(br,1H), 6,61-6,83(m,7H)

(3) Produção de 5-flúor-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

15,4 g (66,3 mmol) de 3-flúor-N1-(4-metoxifenil)-1,2-

fenilenodiamina e 11,6 g (66,6 mmol) de cetomalonato de dietila foram dissolvidos em benzeno (400 mL), e a solução foi aquecida a refluxo por 2 horas removendo ao mesmo tempo água usando um aparato Dean-Stark. A mistura de reação foi concentrada em pressão reduzida, e então o resíduo assim obtido foi dissolvido em acetato de etila e lavado com água, ácido clorídrico 10 % e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi recristalizado a partir de etanol, para obter 14,5 g (rendimento: 64 %) de 5-flúor-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de cristais acidulares de cor magenta.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,43(t,3H), 3,89(s,3H), 4,50(q,2H), 6,56(d,1H), 7,05-7,22(m,5H), 7,39(m,1H)

(4) Produção de ácido 5-flúor-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

14,3 g (41,8 mmol) de 5-flúor-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila foi dissolvido em etanol (100 mL), e 10,0 g (62,5 mmol) de uma solução aquosa 25 % de hidróxido de sódio foi adicionada a ele. A mistura foi agitada por 2 horas a temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada em pressão reduzida, e água foi adicionada ao resíduo assim obtido. A mistura foi acidificada usando ácido clorídrico 10 %. Um sólido precipitado deste foi separado por filtração, lavado com água, e então seco, para obter 11,1 g (rendimento: 84 %) de ácido 5-flúor-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico na forma de um pó amarelo claro.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,93(s,3H), 6,71(d,1H), 7,15-7,29(m,5H), 7,60(m,1H)

[Exemplo de referência 8]

Produção de ácido 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico (Composto No. do intermediário de produção: VI-142)

(1) Produção de 3-cloro-1,2-fenilenodiamina

5 12,5 g (72,4 mmol) de 3-cloro-2-nitroanilina foi dissolvido em metanol (250 mL), e uma solução preparada dissolvendo 57,2 g (253 mmol) de cloreto de estanho (II) diidratado em ácido clorídrico concentrado (75 mL) foi adicionada em gotas. A mistura de reação foi aquecida com agitação por 3 horas, e concentrada em pressão reduzida. Água foi adicionada ao resíduo
10 assim obtido, e a solução foi alcalinizada com uma solução aquosa 25 % de hidróxido de sódio, e extraída com cloreto de metileno. A camada orgânica extraída foi seca sobre sulfato de magnésio anidro, e então concentrada em pressão reduzida, para obter 10,5 g (rendimento: > 99 %) de 3-cloro-1,2-fenilenodiamina na forma de um líquido cor magenta claro.

15 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,58(br,4H), 6,60-6,65(m,2H), 6,82(m, 1H)

(2) Produção de 5-cloro-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

10,5 g (73,6 mmol) de 3-cloro-1,2-fenilenodiamina e 12,8 g
20 (73,5 mmol) de cetomalonato de dietila foram dissolvidos em etanol, e a solução foi aquecida a refluxo por 3 horas. Mantendo ao mesmo tempo aquecimento a refluxo, etanol foi adicionado a ele até que os cristais precipitados se dissolvessem. A mistura de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e então os cristais precipitados foram separados por filtração. A
25 torta do filtro foi lavada com etanol frio, e então seca, para obter 10,5 g (rendimento: 51 %) de 5-cloro-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de cristais acidulares amarelo claro.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,44(t,3H), 4,51(q,2H), 7,26-7,46(m,3H), 12,79(br, 1H)

(3) Produção de 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

A uma lama contendo 5,7 g (22,6 mmol) de 5-cloro-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila, 6,9 g (45,4 mmol) de ácido 4-metoxifenilbórico, 8,2 g (45,1 mmol) de acetato de cobre (II) anidro e clorofórmio (200 mL), 3,6 g (45,5 mmol) de piridina e 4,6 g (45,5 mmol) de trietilamina foram adicionados em gotas, e a mistura foi agitada por 72 horas a temperatura ambiente. A mistura de reação foi lavada com ácido clorídrico 10 %, seca sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi isolado por cromatografia em gel de sílica (solvente de desenvolvimento: acetato de etila:hexano = 2:3), e o sólido isolado foi lavado com éter diisopropílico, para obter 6,3 g (rendimento: 78 %) de 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um pó amarelo claro.

15 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,43(t,3H), 3,89(s,3H), 4,51(q,2H), 6,69(d,1H), 7,11(d,2H),
7,18(d,2H), 7,33(t,1H), 7,44(d,1H)

(4) Produção de ácido 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

20 7,7 g (21,5 mmol) de 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila foi dissolvido em etanol (100 mL), e 6,9 g (43,1 mmol) de uma solução aquosa 25 % de hidróxido de sódio foi adicionada a este. A mistura foi agitada por 12 horas a temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada em pressão reduzida, água foi adicionada ao resíduo assim obtido, e a mistura foi acidificada usando ácido clorídrico 10 %.

25 Um sólido precipitado deste foi separado por filtração, lavado com água, e então seco, para obter 6,7 g (rendimento: 94 %) de ácido 5-cloro-1-(4-metoxifenil)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico na forma de um pó amarelo claro.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,93(s,3H), 6,82(d,1H), 7,17(d,2H), 7,22(d,2H), 7,55(t,1H),
7,62(d,1H)

[Exemplo de referência 9]

5 Produção de ácido 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico (intermediário de produção do composto No. V-155)

(1) Produção de N-(2-nitrofenil)benzo[d][1,3]dioxol-5-ilamina
9,3 g (66 mmol) de 2-flúor-nitrobenzeno e 10 g (73 mmol) de
10 benzo[d][1,3]dioxol-5-ilamina foram dissolvidos em N,N-dimetilformamida (60 mL) e 10,9 g (79 mmol) de carbonato de potássio foi adicionado a este. Solução misturada foi aquecida a refluxo por 10 horas mantendo agitação. A mistura de reação foi vertida em água, e extraída com acetato de etila. A camada orgânica extraída foi lavada com solução aquosa saturada de cloreto
15 de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia em gel de sílica (solvente de desenvolvimento: acetato de etila:hexano = 1:3), para obter 11 g (rendimento: 65 %) de N-(2-nitrofenil)benzo[d][1,3]dioxol-5-ilamina na forma de cristais vermelho-púrpura.

20 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

6,02 (1H, s), 6,76-6,87 (3H, m), 7,23 (1H, d), 7,46 (1H, d),
7,62 (1H, d), 7,99 (1H, d), 8,47 (1H, s)

(2) Produção de N-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)benzeno-1,2-diamina

25 13,6 g (244 mmol) de ferro em pó e 10,5 g (40 mmol) de N-(2-nitrofenil)benzo[d][1,3]dioxol-5-ilamina foram adicionados a uma mistura de solventes de acetato de etila (130 mL), água (65 mL) e ácido acético (15mL), e a mistura foi agitada por 1 hora a 70 °C. A solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o resíduo foi separado por filtração usando um

auxiliar de filtro. A camada orgânica do filtrado foi disposta em lote, lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada em pressão reduzida para obter 9,2 g (rendimento: 99 %) de N-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)benzeno-1,2-diamina na forma de cristais brancos.

5 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,72 (2H, brs), 5,02 (1H, brs), 5,89 (2H, s), 6,20-6,24 (1H, m), 6,38-6,39 (1H, m), 6,67 (1H, d), 6,71-6,80 (2H, m), 6,94-7,05 (2H, m)

(3) Produção de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

10 9,2 g (40 mmol) de N-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)benzeno-1,2-diamina foi dissolvido em tolueno (200 mL), e 8,4 g (48 mmol) de cetomalonato de dietila foi adicionado a este. A mistura foi aquecida a refluxo por 2 horas removendo ao mesmo tempo água usando um aparato Dean-Stark. A solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o solvente foi
15 destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi solidificado usando etanol para obter 13,6 g (rendimento: 49 %) de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um cristal amarelo.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

20 1,44 (3H, t), 4,50 (2H, q), 6,09 (2H, d), 6,74-6,77 (2H, m), 6,83 (1H, d), 7,01 (1H, d), 7,36 (1H, t), 7,47 (1H, t), 7,97 (1H, d)

(4) Produção de ácido 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-2-carboxílico

25 6,7 g (18 mmol) de 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila e 0,9 g (21 mmol) de hidróxido de lítio monoidratado foram dissolvidos em um mistura de solventes de etanol (60 mL) e água (60 mL), e a solução foi agitada por 2 horas a temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada em pressão reduzida e água foi adicionada ao resíduo assim obtido. A mistura foi acidificada usando ácido

clorídrico 10 %. Um sólido precipitado deste foi separado por filtração, lavado com água, e então seco para obter 5,0 g (rendimento: 93 %) de ácido 1-(benzo[d][1,3]dioxol-5-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-2-carboxílico na forma de cristais amarelos.

5 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

6,15 (2H, s), 6,73 (1H, d), 6,88 (1H, d), 7,05 (1H, s), 7,13 (1H, d), 7,40 (1H, t), 7,52 (1H, t), 7,89 (1H, d)

[Exemplo de referência 10]

10 Produção de ácido 1-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico (intermediário de produção do composto No. V-158)

(1) Produção de N-(2-nitrofenil)-2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-amina

15 5,9 g (39 mmol) de 2,3-diidrobenzo[b]1,4-dioxin-6-amina e 5,0 g (35 mmol) de 2-fluoronitrobenzeno foram dissolvidos em N-metilpirrolidona (70 mL) e 20,8 g (150 mmol) de carbonato de potássio foi adicionado a este. O solvente foi aquecido com agitação por 10 horas a 120 °C. A mistura de reação foi vertida em água, e extraída com acetato de etila. A camada orgânica extraída foi lavada com água, ácido clorídrico 10 %, água,
20 e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio nesta ordem, seca sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia em gel de sílica (solvente de desenvolvimento: acetato de etila:hexano = 1:4), para obter 6,4 g (rendimento: 66 %) de N-(2-nitrofenil)-2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-
25 amina na forma de um líquido vermelho.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

4,29 (4H, s), 6,70-6,76 (2H, m), 6,81 (1H, d), 6,90 (1H, d), 7,09 (1H, d), 7,33 (1H, t), 8,18 (1H, d), 9,36 (1H, s)

(2) Produção de N-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-

il)benzeno-1,2-diamina

Uma mistura de 6,3 g (23 mmol) de N-(2-nitrofenil)-2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-amina, 9,0 g (161 mmol) de ferro em pó, ácido acético (1 mL), água (35 mL) e tolueno (70 mL) foram aquecidos a refluxo por 8 horas. A mistura de reação foi filtrada para separar o resíduo. A camada orgânica do filtrado foi separada em lote, lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada em pressão reduzida para obter 5,1 g (rendimento: 91 %) de N-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)benzeno-1,2-diamina) na forma de um líquido marrom.

10 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

3,71 (2H, br), 4,18-4,25 (4H, m), 4,97 (1H, br), 6,29-6,32 (2H, m), 6,70-6,79 (3H, m), 6,95 (1H, t), 7,06 (1H, d)

(3) Produção de 1-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

15 5,0 g (21 mmol) de N-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)benzeno-1,2-diamina e 3,9 g (22 mmol) de cetomalonato de dietila foram dissolvidos em tolueno (60 mL), e a solução foi aquecida a refluxo por 12 horas removendo ao mesmo tempo água usando um aparato Dean-Stark. A solução de reação foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi purificado por cromatografia em gel de sílica (solvente de desenvolvimento: acetato de etila:hexano = 2:3) para obter 4,6 g (rendimento: 63 %) de 1-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila na forma de um pó amarelo leitoso.

25 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,43 (3H, t), 4,30-4,36 (4H, m), 4,50 (2H, q), 6,74-6,85 (3H, m), 7,06 (1H, d), 7,32-7,49 (2H, m), 7,97 (1H, d)

(4) Produção de ácido 1-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

4,5 g (13 mmol) de 1-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila foi dissolvido em etanol (100 mL), e 4,1 g (26 mmol) de uma solução aquosa 25 % de hidróxido de sódio foi adicionado a este. A solução foi agitada por 2 horas a temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada em pressão reduzida e água foi adicionada ao resíduo assim obtido. A mistura foi acidificada usando ácido clorídrico 10 %. Um sólido precipitado deste foi separado por filtração, lavado com água, e então seco para obter 3,9 g (rendimento: 94 %) de ácido 1-(2,3-diidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico na forma de um pó amarelo claro.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

4,35-4,39 (4H, m), 6,77 (1H, d), 6,85 (1H, s), 6,99 (1H, d), 7,14 (1H, d), 7,53-7,67 (2H, m), 8,28 (1H, d)

[Exemplo de referência 11]

Produção de ácido 4-(3-flúor-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico (Composto No. do intermediário de produção: VIII-164)

(1) Produção de N-(3-flúor-4-metilfenil)-3-nitro-2-piridilamina

45 g (0,28 mmol) de 2-cloro-3-nitropiridina foram dissolvidos em 2-etoxietanol (300 mL), e 36 g (0,28 mmol) de 3-flúor-4-metilnilina, ácido clorídrico 12 N e água (300 mL) foram adicionados a ele. Solução misturada foi aquecida a refluxo por 24 horas mantendo agitação. A solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o solvente foi destilado em pressão reduzida. A solução foi extraída com acetato de etila, e lavada com salmoura saturada, e então a camada orgânica obtida foi seca sobre sulfato de magnésio anidro. A mistura foi concentrada em pressão reduzida, e o resíduo assim obtido foi lavado com éter diisopropílico para obter 57 g (rendimento: 82 %) de N-(3-flúor-4-metilfenil)-3-nitro-2-piridilamina.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,27 (3H, d), 6,85 (1H, q), 7,16 (2H, d), 7,60 (1H, d), 8,50 (1H, m), 8,54 (1H, d), 10,10 (1H, brs)

(2) Produção de N2-(3-flúor-4-metilfenil)-2,3-piridinadiamina

57 g (0,23 mol) de N-(3-flúor-4-metilfenil)-3-nitro-2-piridilamina foi dissolvido em acetato de etila (250 mL), e água (125 mL) e ácido acético (80 mL) foram adicionados a ele, e a solução foi aquecida a 50 °C. 77 g (1,40 mol) de ferro em pó foram adicionados à solução de reação, de maneira tal que a temperatura desta não excedesse 60 °C, e então agitada por 1 hora a 60 °C. A solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e a matéria inorgânica foi separada por filtração. A solução foi extraída com acetato de etila, e lavada com salmoura saturada, e então a camada orgânica obtida foi seca sobre sulfato de magnésio anidro. O solvente foi destilado em pressão reduzida, e o resíduo assim obtido foi lavado com hexano para obter 45g (rendimento: 90 %) de N2-(3-flúor-4-metilfenil)-2,3-piridinadiamina.

15 RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,20 (3H, d), 3,27 (2H, s), 6,26 (1H, brs), 6,74-6,86 (2H, m), 6,98-7,14 (3H, m), 7,83 (1H, dd)

(3) Produção de 4-(3-flúor-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato de etila

20 46 g (0,21 mol) de N2-(3-flúor-4-metilfenil)-2,3-piridinadiamina foi dissolvido em tolueno (400 mL), e 40 g (0,23 mol) de cetomalonato de dietila e 92 g de peneira molecular 4A foram adicionados a ele. A solução foi aquecida a refluxo por 12 horas removendo ao mesmo tempo água usando um aparato Dean-Stark. A solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, material inorgânico foi filtrado e o solvente foi destilado em pressão reduzida. O resíduo assim obtido foi lavado com éter diisopropílico para obter 50 g (rendimento: 73 %) de 4-(3-flúor-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

1,44 (3H, t), 2,37 (3H, d), 4,52 (2H, q), 7,01 (2H, d), 7,35-7,42 (2H, m), 8,30 (1H, dd), 8,54 (1H, d)

(4) Produção de ácido 4-(3-flúor-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico

5 45 g (0,14 mol) de 4-(3-flúor-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxilato de etila foram dissolvidos em 1,4-dioxano (300 mL), e uma solução de 39 g (0,28 mol) de carbonato de potássio e água (300 mL) foi adicionado a este. A solução foi agitada por 1 hora a 60 °C. A solução de reação foi resfriada a temperatura ambiente, e o solvente foi
10 destilado em pressão reduzida. Água foi adicionada ao resíduo assim obtido e foi lavada com clorofórmio. Então, a camada aquosa foi ajustada para pH 1 adicionando ácido clorídrico 6 N, e a camada aquosa foi extraída novamente com clorofórmio. Sulfato de magnésio anidro foi adicionado à camada orgânica até secura da camada, e o solvente foi destilado em pressão reduzida
15 para obter 32 g (rendimento: 76 %) de ácido 4-(3-flúor-4-metilfenil)-3-oxo-3,4-diidropirido[2,3-b]pirazina-2-carboxílico.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,41 (3H, d), 7,04 (2H, d), 7,48 (1H, t), 7,55-7,60 (1H, m), 8,63 (1H, dd), 8,70-8,72 (1H, m)

20 [Exemplo de referência 12]

Produção de ácido 1-(6-metilpiridina-2-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico (intermediário de produção do composto No. V-127)

25 (1) Produção de N1-(difenilmetilene)-N2-(6-metilpiridina-2-il)benzeno-1,2-diamina

37,8 g (0,11 mol) de 2-bromo-N-(difenilmetileno)anilina foi dissolvido em tolueno (100 mL), e 14,6 g (0,13 mol) de 2-amino-6-picolina, 5,2 g (5,5 mmol) de tris(dibenzilideneacetona)dipaládio(0), 11,2 g (17,6 mmol) de 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftila, e 15,2 g (0,15 mol) de sódio-

t-butóxido foram adicionados a ele. A mistura foi agitada por 2 horas a 100 °C. A mistura de reação foi vertida em água, e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com salmoura saturada e seca sobre sulfato de magnésio anidro. O solvente foi destilado em pressão reduzida, e o resíduo foi lavado com metanol para obter 42,1 g (rendimento: >99 %) de N1-(difenilmetileno)-N2-(6-metilpiridina-2-il)benzeno-1,2-diamina.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,44 (3H, s), 6,32 (1H, d), 6,64 (3H, m), 6,95 (2H, m), 7,14 (2H, d), 7,25-7,51 (7H, m), 7,75 (2H, d), 7,96 (1H, m)

(2) Produção de N-(6-metilpiridina-2-il)benzeno-1,2-diamina

42,1 g (0,11 mol) de N1-(difenilmetileno)-N2-(6-metilpiridina-2-il)benzeno-1,2-diamina foi dissolvido em tetraidrofuran (100 mL), e 10 % de ácido clorídrico (45 mL) foi adicionado a este, e foi agitado por 2 horas a temperatura ambiente. O solvente foi destilado em pressão reduzida, e água foi adicionada ao resíduo assim obtido e lavada com acetato de etila. Então, a camada aquosa foi ajustada para pH >11, e a camada aquosa foi extraída com cloreto de metileno. A camada orgânica foi lavada com salmoura saturada, e seca sobre sulfato de magnésio anidro, e então o solvente foi destilado em pressão reduzida para obter 19,8 g (rendimento: 83 %) de N-(6-metilpiridina-2-il)benzeno-1,2-diamina.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,43 (3H, s), 3,86 (2H, s), 5,99 (1H, s), 6,21 (1H, d), 6,57 (1H, d), 6,80 (2H, m), 7,05 (1H, t), 7,16 (1H, d), 7,33 (1H, t)

(3) Produção de 1-(6-metilpiridina-2-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila

19,8 g (0,1 mol) de N-(6-metilpiridina-2-il)benzeno-1,2-diamina foram dissolvidos em tolueno (100 mL), e 19,0 g (0,11 mol) de cetomalonato de dietila e 57,1 g de peneira molecular 4A foram adicionados a ele. A solução foi aquecida a refluxo por 3 horas removendo ao mesmo tempo

água usando um aparato Dean-Stark. Mistura de reação foi filtrada e o filtrado foi concentrado em pressão reduzida para obter 27,2 g (rendimento: 89 %) de 1-(6-metilpiridina-2-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

5 1,42 (3H, t), 2,64 (3H, s), 4,51 (2H, q), 6,65 (1H, d), 7,24 (1H, d), 7,43 (3H, m), 7,90 (1H, t), 8,00 (1H, d)

(4) Produção de ácido 1-(6-metilpiridina-2-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico

27,2 g (88 mmol) de 1-(6-metilpiridina-2-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxilato de etila foi dissolvido em 1,4-dioxano (50 mL) e água (50 mL), e 18,3 g (0,13 mol) de carbonato de potássio foi adicionado a este, e a solução foi agitada por 1 hora a 60 °C. O solvente foi destilado em pressão reduzida e a camada aquosa foi ajustada para pH <4. Os cristais precipitados foram filtrados para obter 23,3 g (rendimento: 94 %) de
10 ácido 1-(6-metilpiridina-2-il)-2-oxo-1,2-diidroquinoxalina-3-carboxílico.

RMN-¹H (CDCl₃/TMS δ(ppm)):

2,55 (3H, s), 6,57 (1H, d), 7,47 (4H, m), 7,94 (1H, d), 8,07
(1H, t)

Os valores característicos dos intermediários de produção
20 obtidos nos exemplos de referência anteriores 1 a 12, e os intermediários de produção produzidos da mesma maneira nestes exemplos de referência estão apresentados na tabela 135 a tabela 137.

Tabela 135

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})
V-2	Ponto de Fusão 175-176
V-3	Ponto de Fusão 173-175
V-4	Ponto de Fusão 165-167
V-5	Ponto de Fusão 189-190
V-6	Ponto de Fusão 204-207
V-10	Ponto de Fusão 253-256
V-37	Ponto de Fusão 125-127
V-42	Ponto de Fusão 177-179
V-52	Ponto de Fusão 179-181
V-97	Ponto de Fusão 171-173
V-102	Ponto de Fusão 165-167
V-103	Ponto de Fusão 152-154
V-120	Ponto de Fusão 191-193
V-121	Ponto de Fusão 291-293
V-125	Ponto de Fusão 176-178
V-127	Ponto de Fusão 185-186
V-130	Ponto de Fusão 164-166
V-131	Ponto de Fusão 159-161
V-132	Ponto de Fusão 156-159
V-133	Ponto de Fusão 167-169
V-134	Ponto de Fusão 185-188
V-136	Ponto de Fusão 173-176
V-139	Ponto de Fusão 161-163
V-155	Ponto de Fusão 183-185
V-158	Ponto de Fusão 197-198
V-164	Ponto de Fusão 158-160
V-169	Ponto de Fusão 190-192
V-170	Ponto de Fusão 175-177
V-172	Ponto de Fusão 185-186
V-174	Ponto de Fusão 190-192
V-176	Ponto de Fusão 204-205
V-174	Ponto de Fusão 190-192
V-189	Ponto de Fusão 207-208
V-191	Ponto de Fusão 209-210
V-193	Ponto de Fusão 207-209
V-195	Ponto de Fusão 214-216
V-198	Ponto de Fusão 181-183

Tabela 136

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n _D ²⁰)
V-207	Ponto de Fusão 145- 147
V-212	Ponto de Fusão 187- 189
V-213	Ponto de Fusão 170-172
V-214	Ponto de Fusão 172- 173
V-217	Ponto de Fusão 210-212
V-221	Ponto de Fusão 157- 188
V-222	Ponto de Fusão 173-175
V-223	Ponto de Fusão 167-169
V-224	Ponto de Fusão 197- 199
V-225	Ponto de Fusão 179-180
V-305	Ponto de Fusão 170- 173
V-306	Ponto de Fusão 135- 140
V-307	Ponto de Fusão 181-183
V-308	Ponto de Fusão 202-204
V-311	Ponto de Fusão 187- 188
V-313	Ponto de Fusão 103- 165
V-314	Ponto de Fusão 140- 143
V-315	Ponto de Fusão 167- 169
V-316	Ponto de Fusão 197-199
V-317	Ponto de Fusão 180- 182
V-318	Ponto de Fusão 201-203
VI-34	Ponto de Fusão 173- 175
VI-54	Ponto de Fusão 162- 163
VI-77	Ponto de Fusão 183- 185
VI-122	Ponto de Fusão 176- 178
VI-135	Ponto de Fusão 195-197
VI-136	Ponto de Fusão 191-192
VI-137	Ponto de Fusão 165-166
VI- 138	Ponto de Fusão 182- 184
VI-141	Ponto de Fusão 159- 161
VI- 142	Ponto de Fusão 195-200
VI- 154	Ponto de Fusão 163-165
VI-156	Ponto de Fusão 179-180
VI-101	Ponto de Fusão 182-183
VI- 103	Ponto de Fusão 196-198
VI- 167	Ponto de Fusão 154- 150
VI- 170	Ponto de Fusão 185-187
VI-171	Ponto de Fusão 205-209
VI-174	Ponto de Fusão 220-222
VI-175	Ponto de Fusão 156-159
VI- 177	Ponto de Fusão 200-201
VI- 179	Ponto de Fusão 175- 176
VI- 180	Ponto de Fusão 199-200
VI-181	Ponto de Fusão 174-176
VI- 182	Ponto de Fusão 186- 189
VI- 184	Ponto de Fusão 182-184

Tabela 137

Composto No.	Ponto de Fusão(°C) ou Taxa Refrativa (n_D^{20})	
VI-187	Ponto de Fusão	192-193
VI- 188	Ponto de Fusão	186-187
VI-190	Ponto de Fusão	193-194
VI- 191	Ponto de Fusão	>300
VI-192	Ponto de Fusão	99-101
VI-193	Ponto de Fusão	177-180
VI-194	Ponto de Fusão	177-178
VI-196	Ponto de Fusão	166-168
VI-197	Ponto de Fusão	184-186
VI-199	Ponto de Fusão	164-165
VI-200	Ponto de Fusão	200-201
VI-201	Ponto de Fusão	192-195
VI-239	Ponto de Fusão	195-196
VI-240	Ponto de Fusão	155-157
VI-241	Ponto de Fusão	141-143
VI-244	Ponto de Fusão	215-217
VI-245	Ponto de Fusão	183-184
VI-246	Ponto de Fusão	197-198
VI-247	Ponto de Fusão	198-200
VII-3	Ponto de Fusão	143-144
VII-4	Ponto de Fusão	144-147
VII-5	Ponto de Fusão	157-158
VII-7	Ponto de Fusão	119-120
VII-8	Ponto de Fusão	140-141
VII-61	Ponto de Fusão	127-129
VII-78	Ponto de Fusão	131-132
VII-79	Ponto de Fusão	159-160
VII-82	Ponto de Fusão	162-165
VII-88	Ponto de Fusão	182-184
VII-89	Ponto de Fusão	176-178
VII-126	Ponto de Fusão	232-235
VII-128	Ponto de Fusão	161-163
VII-175	Ponto de Fusão	160-162
VIII-1	Ponto de Fusão	178-179
VIII-7	Ponto de Fusão	159-161
VIII-13	Ponto de Fusão	182-183
VIII-27	Ponto de Fusão	104-107
VIII-125	Ponto de Fusão	123-126

[Dados de RMN]

Para os composto Nos. V-7, V-14, V-29, V-35, V-40, V-51, V-58, V-60, V-61, V-62, V-64, V-71, V-72, V-73, V-101, V-113, V-117, V-119, V-152, V-154, V-156, V-158, V-160, V-162, V-179, V-186, V-197, V-205, V-211, V-216, V-217, V-218, V-226, V-310, V-319, VI-1, VI-6, VI-7, VI-13, VI-21, VI-27, VI-31, VI-33, VI-36, VI-37, VI-49, VI-54, VI-55, VI-57, VI-88, VI-94, VI-115, VI-116, VI-117, VI-121, VI-122, VI-123, VI-125, VI-133, VI-134, VI-144, VI-150, VI-152, VI-153, VI-156, VI-157, VI-159, VI-160, VI-161, VI-162, VI-165, VI-170, VI-173, VI-185, VI-189, VI-195, VI-198, VI-242, VI-243, VI-248, VII-59, VII-67, VII-91, VII-97, VII-102, VII-153, VII-154, VII-156, VII-171, VII-173, VII-176, VII-177, VII-178, VII-180, VII-181, VII-185, VII-186, VII-187, VII-188, VIII-2, VIII-3, VIII-4, VIII-5, VIII-6, VIII-11, VIII-12, VIII-15, VIII-16, VIII-22, VIII-28, VIII-53, VIII-54, VIII-55, VIII-56, VIII-57, VIII-58, VIII-76, VIII-84, VIII-98, VIII-99, VIII-100, VIII-101, VIII-102, VIII-103, VIII-104, VIII-106, VIII-107, VIII-108, VIII-109, VIII-113, VIII-114, VIII-116, VIII-117, VIII-118, VIII-121, VIII-126, VIII-127, VIII-128, VIII-132, VIII-133, VIII-134, VIII-135, VIII-136, VIII-137, VIII-139, VIII-142, VIII-143, VIII-144, VIII-145, VIII-150, VIII-152, VIII-153, VIII-154, VIII-155, VIII-156, VIII-157, VIII-158, VIII-159, VIII-160, VIII-161, VIII-162, VIII-163, VIII-164, VIII-165, VIII-166, VIII-167, VIII-168, VIII-169, VIII-170, VIII-171, VIII-172, VIII-173, VIII-174, VIII-175, VIII-176, VIII-177, VIII-178, VIII-179, VIII-180, VIII-181, VIII-182, VIII-183, VIII-184, VIII-185, VIII-187, VIII-190, VIII-192, VIII-193, VIII-194, VIII-195, VIII-196, VIII-197, VIII-198, VIII-199, VIII-200, VIII-201, VIII-202, VIII-203, VIII-204, VIII-208, VIII-209, VIII-210, VIII-211, VIII-212, VIII-213, VIII-214, VIII-215, VIII-216 e VIII-218, os dados de RMN-¹H (valor CDCl₃/TMS δ (ppm)) estão apresentados a seguir.

Composto No. V-7 :

1,04 (3H, t), 1,43-1,56 (2H, m), 1,78-1,86 (2H, m), 4,41 (2H,

t), 7,51 (1H, d), 7,58 (1H, dd), 7,84 (1H, m), 8,28 (1H, dd), 14,33 (1H, brs)

Composto No. V-14 :

0,92 (3H, t), 1,35-1,38 (4H, m), 1,49 (2H, m), 1,83 (2H, m),
4,39 (2H, t), 7,51 (1H, d), 7,58 (1H, m), 7,84 (1H, m), 8,28 (1H, d), 14,33
5 (1H, brs)

Composto No. V-29 :

3,49 (3H, s), 5,86 (2H, s), 7,59 (1H, t), 7,70 (1H, d), 7,83 (1H,
t), 8,25 (1H, dd)

Composto No. V-35 :

10 4,14 (2H, q), 5,98 (2H, s), 7,60 - 7,68 (2H, m), 7,86 (1H, t),
8,26 (1H, d)

Composto No. V-40 :

2,65 (2H, t), 3,93 (2H, t), 5,95 (2H, s), 7,62 (1H, t), 7,71 (1H,
d), 7,86 (1H, t), 8,26 (1H, dd), 13,66 (1H, bs)

15 Composto No. V-51 :

3,18 (3H, s), 5,86 (2H, s), 7,50 (1H, m), 7,72-7,80 (2H, m),
7,91 (1H, d)

Composto No. V-58 :

20 3,33 (3H, s), 3,84 (2H, t), 4,62 (2H, t), 7,59 (1H, t), 7,71 (1H,
d), 7,82 (1H, t), 8,25 (1H, dd), 14,20 (1H, bs)

Composto No. V-60 :

1,68 (3H, d), 3,31 (3H, s), 3,79-3,84 (1H, m), 4,21-4,28 (1H,
m), 4,87-5,28 (1H, m), 7,55 (1H, t), 7,72 (1H, d), 7,79 (1H, t), 8,26 (1H, dd),
14,28 (1H, bs)

25 Composto No. V-61 :

2,28 (3H, s), 2,92 (2H, m), 4,63 (2H, m), 7,51-7,62 (2H, m),
7,86 (1H, m), 8,28 (1H, dd)

Composto No. V-62 :

3,11 (3H, s), 3,54 (2H, t), 4,89 (2H, t), 7,61-7,69 (2H, m), 7,91

(1H, dd), 8,30 (1H, d)

Composto No. V-64 :

2,44 (3H, s), 5,26 (2H, t), 7,15 (1H, d), 7,58 (1H, t), 7,78 (1H, t), 8,27 (1H, dd), 13,70 (1H, bs)

5 Composto No. V-71 :

3,66 - 3,78 (6H, m), 3,84 - 3,87 (3H, m), 7,31 (1H, d), 7,53 (1H, t), 7,77 (1H, t), 8,15 (1H, dd)

Composto No. V-72 :

5,38 (2H, t), 7,50 - 7,57 (2H, m), 7,80 (1H, t), 8,04 (1H, dd)

10 Composto No. V-73 :

2,99 (2H, t), 4,55 (2H, t), 7,46 (1H, t), 7,43 (1H, t), 7,82 (1H, d), 7,89 (1H, d), 13,98 (1H, bs)

Composto No. V-101 :

15 m), 8,29 (1H, d)

Composto No. V-113 :

7,08 (1H, d), 7,61 (1H, t), 7,71 (1H, t), 7,77 (1H, d), 8,04 (1H, d), 8,30 (1H, d)

Composto No. V-117 :

20 2,84 (3H, s), 6,98 (1H, d), 7,62 (1H, t), 7,74 (1H, t), 8,30 (1H, d)

Composto No. V-119 :

d) 3,91 (3H, s), 6,90 (1H, d), 7,67 (1H, t), 7,79 (1H, t), 8,31 (1H, d)

25 Composto No. V-152 :

6,74 (1H, d), 7,64 (2H, m), 8,33 (1H, d), 8,85 (2H, s), 8,93 (1H, s), 13,32 (1H, bs)

Composto No. V-154 :

3,33-3,38 (2H, m), 4,74(2H, t), 2,37-2,44 (1H, m), 2,90-2,92

(2H, m), 6,98 (1H, d), 7,03 (2H, s), 7,12 (1H, s), 7,55 (1H, t), 7,65 (1H, t), 8,29 (1H, d)

Composto No. V-156 :

5 6,89(1H, d), 7,09(2H, m), 7,37(1H, d), 7,59(1H, t), 7,68(1H, t), 8,32(1H, d)

Composto No. V-158 :

4,35-4,39 (4H, m), 6,78 (1H, dd), 6,85 (1H, d), 6,99 (1H, dd), 7,14 (1H, d), 7,55 (1H, m), 7,66 (1H, d), 8,29 (1H, dd), 13,97 (1H, brs)

Composto No. V-160 :

10 1,78-1,82 (1H, m), 1,96-2,03 (2H, m), 1,29-2,22 (1H, m), 3,76 (1H, q), 3,90 (1H, q), 4,37-4,48 (2H, m), 4,59 (1H, dd), 4,56 (1H, t), 7,72 (1H, d), 7,81 (1H, t), 8,24 (1H, d), 14,05 (1H, bs)

Composto No. V-162 :

15 2,28 (3H, s), 5,66 (2H, s), 7,62 (1H, t), 7,71 (1H, d), 7,87 (1H, t), 8,28 (1H, d)

Composto No. V-179 :

3,34 (3H, s), 3,81 (2H, t), 5,20 (2H, t), 7,49 (1H, t), 7,84 (1H, dd), 8,20 (1H, t), 13,96 (1H, bs)

Composto No. V-186 :

20 3,67 (3H, s), 3,96 (3H, s), 7,05-7,11 (2H, m), 7,82 (1H, d), 13,88 (1H, br)

Composto No. V-197 :

3,82 (3H, m), 7,58 (1H, d), 8,53 (1H, d), 8,88 (1H, s)

Composto No. V-205 :

25 6,68 (1H, d), 7,20 (1H, d), 7,48-7,64 (5H, m), 7,74 (1H, t), 8,06 (1H, d), 8,17 (1H, d), 8,37 (1H, d)

Composto No. V-211 :

6,98 (1H, s), 7,51 (1H, t), 7,64 (1H, t), 7,95 (1H, s), 9,32 (1H, s)

Composto No. V-216 :

1,20-1,31 (9H, m), 3,44 (1H, m), 3,55 (1H, m), 4,12 (1H, m),
5,31 (2H, br), 7,13 (1H, br), 7,56 (1H, br), 7,71 (1H, br), 8,25 (1H, br)

Composto No. V-217 :

5 3,36(3H, s), 4,77(2H, s), 6,95(3H, m), 7,27(1H, d), 7,58(1H, t),
7,67(1H, t), 8,31(1H, d)

Composto No. V-218 :

3,70 (3H, s), 3,91(3H, s), 6,61 (1H, d), 6,92 (1H, d), 7,08 (1H,
d), 7,25 (2H, s), 7,51-7,61 (4H, m), 8,30 (1H, d)

10 Composto No. V-226 :

2,55 (3H, s), 6,77 (1H, d), 7,37 (1H, d), 7,50 (1H, d), 7,93
(1H,d), 8,22 (1H, d), 8,65 (1H, s)

Composto No. V-310 :

15 4,06 (3H, s), 6,84 (1H, d), 7,05 (1H, d), 7,52-7,66 (m, 3H),
8,15 (1H, S)

Composto No. V-319 :

3,75 (3H, s), 6,97 (2H, t), 7,58 (1H, t), 7,66-7,72 (2H, m), 8,30
(1H, d)

[0295]

20 Composto No. VI-1 :

6,87 (1H, d), 7,34 (2H, d), 7,54-7,74 (5H, m), 8,31 (1H, d)

Composto No. VI-6 :

6,87 (1H, d), 7,27 (1H, m), 7,38 (1H, s), 7,56-7,70 (4H, m),
8,31 (1H, d), 13,33 (1H, brs)

25 Composto No. VI-7 :

6,88 (1H, dd), 7,30-7,33 (2H, m), 7,57 (1H, m), 7,58-7,70 (3H,
m), 8,30 (1H, dd), 13,71 (1H, brs)

Composto No. VI-13 :

2,52 (3H, s), 6,92 (1H, dd), 7,21-7,24 (2H, m), 7,47-7,67 (4H,

m), 8,29 (1H, dd), 13,91 (1H, brs)

Composto No. VI-21 :

1,32 (6H, d), 3,05 (1H, m), 6,87 (1H, dd), 7,13-7,18 (2H, m),
7,52-7,66 (4H, m), 8,31 (1H, dd), 13,99 (1H, brs)

5 Composto No. VI-27 :

6,81 (1H, d), 7,58-7,62 (2H, m), 7,66-7,71 (2H, m), 7,88 (1H,
dd), 7,95 (1H, d), 8,32 (1H, d), 13,58 (1H, brs)

Composto No. VI-31 :

6,89 (1H, d), 7,05-7,13 (4H, m), 7,47 (1H, t), 7,58 (1H, t), 8,09
10 (1H, d)

Composto No. VI-33 :

3,88 (3H, s), 6,85 (1H, dd), 6,89-6,94 (2H, m), 7,19 (1H, dd),
7,54-7,68 (3H, m), 8,31 (1H, dd), 13,76 (1H, brs)

Composto No. VI-36 :

15 1,45 (3H, t), 4,09 (2H, m), 6,83-6,94 (3H, m), 7,17 (1H, dd),
7,53-7,67 (3H, m), 8,30 (1H, dd)

Composto No. VI-37 :

1,50 (3H, t), 4,15 (2H, q), 6,94 (1H, d), 7,14-7,28 (4H, m),
7,53-7,66 (2H, m), 8,30 (1H, dd), 13,98 (1H, brs)

20 Composto No. VI-49 :

4,65 (2H, d), 5,37 (1H, d), 5,48 (1H, d), 6,06-6,15 (1H, m),
6,93 (1H, d), 7,17-7,26 (4H, m), 7,56 (1H, t), 7,64 (1H, t), 8,30 (1H, d).

Composto No. VI-54 :

6,62(1H, t), 6,86(1H, m), 7,15(1H, m), 7,21(1H, d), 7,44(1H,
25 d), 7,67(3H, m), 8,32(1H, d)

Composto No. VI-55 :

6,82 (1H, t), 6,84 (1H, d), 7,30-7,44 (4H, m), 7,59 (1H, t), 7,61
(1H, t), 8,17 (1H, d)

Composto No. VI-57 :

6,85 (1H, dd), 7,32 (1H, d), 7,53-7,62 (2H, m), 7,68 (1H, m),
7,77 (1H, dd), 8,33 (1H, dd)

Composto No. VI-88 :

2,73 (3H, s), 6,83 (1H, d), 7,48 (1H, d), 7,59 (1H, t), 7,64 (1H,
5 t), 8,27-8,34 (3H, m)

Composto No. VI-94 :

4,01 (3H, s), 6,81 (1H, d), 7,43-7,65 (4H, m), 8,31-8,43 (3H,
m)

Composto No. VI-115 :

3,94 (3H, s), 6,87-6,93 (3H, m), 7,58 (1H, dd), 7,65-7,70 (2H,
10 m), 8,31 (1H, m)

Composto No. VI-116 :

2,35 (3H, s), 3,85 (3H, s), 6,72 (1H, d), 6,82 (1H, dd), 6,95
(1H, dd), 7,42 (1H, d), 7,56 (1H, m), 7,65 (1H, m), 8,30 (1H, dd)

15 Composto No. VI-117 :

3,90 (3H, s), 4,00 (3H, s), 6,79 (1H, d), 6,89-6,97 (2H, m),
7,13 (1H, d), 7,57 (1H, m), 7,66 (1H, m), 8,30 (1H, d), 13,76 (1H, brs)

Composto No. VI-121 :

3,84 (6H, s), 6,43-6,45 (2H, m), 6,70 (1H, dd), 6,98 (1H, d),
20 7,56 (1H, m), 7,66 (1H, m), 8,30 (1H, m)

Composto No. VI-122 :

3,90 (3H, s), 6,92-6,99 (2H, m), 7,08 (1H, d), 7,25 (1H, d),
7,57 (1H, t), 7,68 (1H, t), 8,30 (1H, d)

Composto No. VI-123 :

25 3,93 (3H, s), 6,81 (1H, d), 7,08 (1H, d), 7,23-7,30 (2H, m),
7,57 (1H, t), 7,66 (1H, t), 8,32 (1H, d)

Composto No. VI-125 :

3,74(1H, s), 3,92(1H, s), 6,72(2H, m), 6,91(1H, d), 7,16(1H,
m), 7,53(1H, t), 7,63(1H, t), 8,29(1H, d)

Composto No. VI-133 :

3,88 (6H, s), 3,97 (3H, s), 6,54 (2H, s), 6,97 (1H, d), 7,58 (1H, m), 7,69 (1H, m), 8,30 (1H, d), 13,60 (1H, brs)

Composto No. VI-134 :

5 3,93 (s, 3H), 6,71 (d, 1H), 7,16-7,29 (m, 5H), 7,58 (m, 1H)

Composto No. VI-144 :

3,94 (3H, s), 6,89 (1H, s), 7,18-7,24 (4H, m), 7,52 (1H, d), 8,22 (1H, d)

Composto No. VI-150 :

10 0,39-0,43 (2H, m), 0,69-0,74 (2H, m), 1,31-1,37 (1H, m), 3,91 (2H, d), 6,93 (1H, d), 7,16-7,24 (2H, m), 7,57 (1H, t), 7,65 (1H, t), 8,29 (1H, d)

Composto No. VI-152 :

15 3,08 (6H, s), 6,88 (2H, d), 6,90 (1H, d), 7,13 (2H, d), 7,53(1H, t), 7,61 (1H, t), 8,28 (1H, d)

Composto No. VI-153 :

2,38 (3H, s), 2,41 (3H, s), 6,91 (1H, d), 7,01-7,08 (2H, m), 7,44 (1H, d), 7,55 (1H, t), 7,61 (1H, t), 8,29 (1H, d)

Composto No. VI-156 :

20 2,40(3H, d), 6,88(1H, d), 7,15(2H, m), 7,33(1H, t), 7,57(1H, t), 7,66(1H, t), 8,30(1H, d)

Composto No. VI-157 :

2,51 (3H, s), 6,78 (1H, d), 7,25 (1H, d), 7,39 (1H, d), 7,55-7,68 (3H, m), 8,32 (1H, d)

25 Composto No. VI-159 :

1,49(3H, t), 3,99(3H, s), 4,12(2H, m), 6,77(1H, d), 6,88(1H, m), 6,95(1H, d), 7,11(1H, d), 7,56(1H, t), 7,65(1H, t), 8,30(1H, d)

Composto No. VI-160 :

3,81 (3H, s), 3,97 (6H, d), 6,88-6,96 (3H, m), 7,57 (1H, t),

7,65 (1H, t), 8,29 (1H, d)

Composto No. VI-161 :

4,01(3H, s), 6,95(1H, d), 7,05(1H, m), 7,12(1H, m), 7,58(1H, t), 7,70(1H, m), 8,32(1H, m)

5 Composto No. VI-162 :

4,16(3H, s), 6,97(3H, m), 7,60(1H, t), 7,70(1H, t), 8,31(1H, d)

Composto No. VI-165 :

1,68-1,81 (4H, m), 2,10-2,16 (1H, m), 2,37-2,44 (1H, m), 2,90-2,92 (2H, m), 6,99-7,02 (1H, m), 7,37 (2H, t), 7,56-7,68 (2H, m), 8,31 (1H, d)

10

Composto No. VI-170 :

2,30(2H, m), 4,30(2H, m), 4,43(2H, m), 6,86(1H, m), 6,93(2H, m), 7,22(2H, d), 7,55(1H, t), 7,65(1H, t), 8,29(1H, d)

Composto No. VI-173 :

15 4,16(3H, s), 6,70(1H, d), 6,95(2H, m), 7,25(1H, t), 7,65(1H, m))

Composto No. VI-185 :

2,43 (3H, s), 3,94 (3H, s), 6,67 (1H, s), 7,22 (4H, m), 7,35 (1H, s), 8,16 (1H, s), 13,99 (1H, s)

20 Composto No. VI-189 :

3,91 (3H, s), 3,92 (3H, s), 6,86 (1H, d), 7,20 (5H, m), 7,71 (1H, s)

Composto No. VI-195 :

25 3,45 (3H, s), 3,90 (3H, s), 7,05 (2H, d), 7,19 (3H, d), 7,48 (1H, t), 7,92 (1H, d)

Composto No. VI-198 :

6,67 (1H, dd), 7,32 (2H, d), 7,68-7,76 (3H, m), 8,12 (1H, dd)

Composto No. VI-242 :

3,80 (3H, s), 6,17(1H, d), 7,13(1H, m), 7,35(4H, m), 8,20(1H,

d)

Composto No. VI-243 :

3,81 (3H, s), 6,18(1H, d), 6,66(1H, t), 7,14(1H, m), 7,35(2H, d), 7,44(2H, d), 8,22(1H, d)

5

Composto No. VI-248 :

6,64 (1H, d), 7,28-7,43 (5H, m), 7,62 (1H, m)

[0296]

Composto No. VII-59 :

10 3,56 (3H, s), 3,86 (2H, t), 4,91 (2H, t), 7,55 - 7,59 (1H, m),
8,58 (1H, dd), 8,84 (1H, dd), 14,01 (1H, bs)

Composto No. VII-67 :

1,32 (3H, t), 2,28 (2H, q), 5,38 (2H, s), 7,56-7,61 (1H, m),
8,60 (1H, d), 8,79 (1H, d)

Composto No. VII-91 :

15 3,86 (3H, s), 5,87 (2H, s), 6,78 (2H, q), 6,92 (1H, d), 7,29 (1H, s),
7,55 (1H, q), 8,60 (1H, d), 8,80 (1H, d)

Composto No. VII-97 :

2,08(3H, d), 7,32(4H, m), 7,44(2H, m), 7,57(1H, m), 8,57(1H, m),
8,82(1H, d)

20

Composto No. VII-102 :

7,12 (1H, d), 7,43-7,47 (1H, m), 7,55-7,58 (2H, m), 8,31 (H, d),
8,56 (1H, d)

Composto No. VII-153 :

25 6,13(1H, s), 6,77(2H, m), 7,04(1H, m), 7,57(1H, m), 8,62(1H, m),
8,73(1H, d)

Composto No. VII-154 :

7,05(2H, m), 7,32(1H, d), 7,60(1H, q), 8,68(2H, m)

Composto No. VII-156 :

4,35(4H, m), 6,77(1H, q), 6,85(1H, d), 7,11(1H, d), 7,56(1H,

q), 8,62(1H, q), 8,74(1H, q)

Composto No. VII-171 :

1,57 (3H, s), 1,67 (3H, s), 2,51 (2H, q), 4,63 (2H, t), 5,22 (1H, t), 7,54 - 7,58 (1H, m), 8,56 (1H, d), 8,85 (1H, d), 14,12 (1H, bs)

5 Composto No. VII-173 :

1,74 (3H, t), 2,52 (2H, t), 4,75 (2H, t), 7,56 - 7,67 (1H, m), 8,58 (1H, d), 8,84 (1H, d), 14,00 (1H, bs)

Composto No. VII-176 :

10 3,10 (2H, t), 4,86 (2H, t), 7,24-7,31 (5H, m), 7,56 (1H, q), 8,57 (1H, d), 8,84 (1H, d)

Composto No. VII-177 :

5,99 (2H, s), 6,95 (1H, q), 7,25 (1H, q), 7,36 (1H, d), 7,60 (1H, q), 8,57 (1H, dd), 8,93 (1H, dd)

Composto No. VII-178 :

15 6,54 (1H, d), 6,98 (2H, s), 7,64 (1H, q), 8,05 (1H, d), 8,58 (1H, dd), 8,92 (1H, dd)

Composto No. VII-180 :

2,37 (3H, s), 5,75 (2H, s), 6,07 (1H, s), 7,47 (1H, q), 8,34 (1H, dd), 8,71 (1H, dd)

20 Composto No. VII-181 :

5,81 (2H, s), 7,30 (1H, d), 7,62 (1H, q), 7,95 (1H, dd), 8,59 (1H, dd), 8,72 (1H, d), 8,89 (1H, dd)

Composto No. VII-185 :

25 2,86 (3H, s), 5,82 (2H, s), 7,28-7,33 (3H, m), 7,39 (1H, d), 7,54 (2H, t), 8,69 (1H, d)

Composto No. VII-186 :

2,54 (3H, s), 5,82 (2H, s), 7,28-7,33 (3H, m), 7,55 (2H, t), 8,34 (1H, d), 8,72 (1H, d)

Composto No. VII-187 :

2,81 (3H, s), 5,83 (2H, s), 7,29-7,36 (3H, m), 7,41 (1H, d),
7,58 (2H, t), 8,42 (1H, d)

Composto No. VII-188 :

4,14 (3H, s), 5,76 (2H, s), 6,96 (1H, d), 7,32-7,37 (3H, m),
5 7,49 (2H, dd), 8,36 (1H, d)

[0297]

Composto No. VIII-2 :

7,36-7,46 (3H, m), 7,56-7,67 (2H, m), 8,63-8,70 (2H, m),
13,36 (1H, br)

10 Composto No. VIII-3 :

7,08-7,15 (2H, m), 7,31-7,38 (1H, m), 7,57-7,68 (2H, m),
8,63-8,71 (2H, m), 13,32 (1H, br)

Composto No. VIII-4 :

7,27-7,38 (4H, m), 7,58 (1H, dd), 8,63-8,71 (2H, m), 13,57
15 (1H, br)

Composto No. VIII-5 :

7,36-7,40 (1H, m), 7,55-7,72 (4H, m), 8,64-8,69 (2H, m),
13,08 (1H, br)

Composto No. VIII-6 :

20 7,22-7,26 (1H, m), 7,36 (1H, s), 7,57-7,61 (3H, m), 8,64 (1H,
dd), 8,70 (1H, dd), 13,29 (1H, br)

Composto No. VIII-11 :

2,07 (3H, s), 7,18 (1H, d), 7,44-7,59 (4H, m), 8,62 (1H, d),
8,70-8,72 (1H, m), 13,40 (1H, br)

25 Composto No. VIII-12 :

2,48 (3H, s), 7,10-7,13 (2H, m), 7,44 (1H, d), 7,53-7,58 (2H,
m), 8,64 (1H, dd), 8,71 (1H, dd), 13,71 (1H, br)

Composto No. VIII-15 :

1,31(3H, t), 2,79(2H, q), 7,13(2H, m), 7,46(1H, d), 7,55(2H,

m), 8,63(1H, m), 8,71(1H, m)

Composto No. VIII-16 :

1,39(3H, t), 2,80(2H, q), 7,24(2H, d), 7,48(2H, d), 7,55(1H, q),
8,63(1H, m), 8,72(1H, m)

5 Composto No. VIII-22 :

1,35(6H, d), 3,06(1H, m), 7,25(2H, d), 7,54(3H, m), 8,63(1H,
m), 8,71(1H, m)

Composto No. VIII-28 :

7,49 (2H, d), 7,60 (1H, q), 7,93 (2H, d), 8,63-8,69 (2H, m),
10 13,25 (1H, br)

Composto No. VIII-53 :

6,40(1H, t), 7,55(5H, m), 8,66(2H, m)

Composto No. VIII-54 :

6,60(1H, t), 7,13(1H, s), 7,20(1H, d), 7,39(1H, d), 7,58(1H, q),
15 7,67(1H, t), 8,69 (2H, m)

Composto No. VIII-55 :

6,65(1H, t), 7,36(4H, m), 7,58(1H, m), 8,67(2H, m)

Composto No. VIII-56 :

7,43 (1H, d), 7,53-7,64 (3H, m), 7,68 (1H, d), 8,63-8,68 (2H,
20 m)

Composto No. VIII-57 :

7,24-7,32 (2H, m), 7,49 (2H, d), 7,59 (1H, q), 7,70 (1H, t),
8,63-8,70 (2H, m), 13,12 (1H, br)

Composto No. VIII-58 :

7,37-7,41 (2H, m), 7,49 (2H, d), 7,58-7,61 (1H, m), 8,64-8,70
25 (2H, m), 13,48 (1H, br)

Composto No. VIII-76 :

7,40 (2H, d), 7,59 (1H, q), 7,93 (2H, d), 8,65 (2H, m)

Composto No. VIII-84 :

7,61 (2H, q), 7,67 (1H, s), 7,79 (1H, t), 7,91 (1H, d), 8,66 (2H,

q)

Composto No. VIII-98 :

7,15-7,18 (1H, m), 7,37-7,41 (1H, m), 7,43-7,50 (1H, m),

5 7,59-7,62 (1H, m), 8,64-8,70 (2H, m), 13,20 (1H, br)

Composto No. VIII-99 :

7,13-7,18 (1H, m), 7,36-7,41 (1H, m), 7,58-7,61 (1H, m),

8,59-8,70 (2H, m), 13,27 (1H, br)

Composto No. VIII-100 :

10 7,13-7,18 (1H, m), 7,30-7,39 (2H, m), 7,59-7,62 (1H, m),

8,63-8,70 (2H, m), 10,81 (1H, br)

Composto No. VIII-101 :

7,18-7,27 (2H, m), 7,57-7,63 (2H, m), 8,63-8,70 (1H, m),

12,55 (1H, br)

15 Composto No. VIII-102 :

7,10-7,15 (1H, m), 7,20-7,27 (1H, m), 7,41-7,50 (1H, m),

7,58-7,62 (1H, m), 8,63-8,71 (2H, m), 12,80 (1H, br)

Composto No. VIII-103 :

6,91-6,95 (2H, m), 7,06-7,13 (1H, m), 7,58-7,62 (1H, m),

20 8,63-8,71 (2H, m), 13,20 (1H, br)

Composto No. VIII-104 :

7,32 (1H, dd), 7,43-7,49 (2H, m), 7,69 (1H, dd), 8,53 (1H, dd)

Composto No. VIII-106 :

7,42-7,52 (3H, m), 7,59 (1H, d), 8,39 (1H, dd), 8,54 (1H, dd)

25 Composto No. VIII-107 :

7,52-7,62 (4H, m), 8,65-8,68 (2H, m)

Composto No. VIII-108 :

7,20 (1H, dd), 7,47 (1H, d), 7,60 (1H, q), 7,73 (1H, d), 8,64

(1H, dd), 8,70 (1H, dd)

Composto No. VIII-109 :

7,28 (1H, s), 7,40 (1H, s), 7,46 (1H, q), 7,54 (1H, t), 8,38 (1H, dd), 8,60 (1H, dd)

Composto No. VIII-113 :

5 3,69 (3H, s), 3,95 (3H, s), 6,84 (1H, dd), 7,15 (1H, dd), 7,25 (1H, t), 7,44 (1H, q), 8,39 (1H, dd), 8,56 (1H, dd)

Composto No. VIII-114 :

3,91 (1H, s), 6,84-6,92 (2H, m), 7,34 (1H, dd), 7,58 (1H, dd), 8,64 (1H, dd), 8,72 (1H, dd), 13,55 (1H, br)

10 Composto No. VIII-116 :

2,29 (3H, s), 3,81 (3H, s), 6,78 (1H, s), 6,80 (1H, dd), 7,33 (1H, d), 7,44 (1H, q), 8,37 (1H, dd), 8,58 (1H, dd)

Composto No. VIII-117 :

15 3,88 (3H, s), 3,97 (3H, s), 6,80 (1H, d), 6,89 (1H, dd), 7,09 (1H, d), 7,51 (1H, q), 8,53 (1H, dd), 8,68 (1H, dd)

Composto No. VIII-118 :

3,86 (3H, s), 6,64-6,68 (2H, m), 6,87 (1H, dt), 7,59 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,72 (1H, dd)

Composto No. VIII-121 :

20 3,82 (6H, s), 6,44 (1H, d), 6,65 (1H, d), 7,50 (1H, q), 8,51 (1H, dd), 8,67 (1H, dd)

Composto No. VIII-126 :

7,09(2H, m), 7,21(1H, t), 7,58(1H, q), 8,63(1H, m), 8,72(1H, m)

25 Composto No. VIII-127 :

4,01(3H, s), 7,21(2H, m), 7,38(1H, d), 7,58(1H, q), 8,62(1H, m), 8,71(1H, m)

Composto No. VIII-128 :

2,30 (3H, s), 3,93 (3H, s), 7,04-7,15 (3H, m), 7,56 (1H, q),

8,63 (1H, dd), 8,74 (1H, dd)

Composto No. VIII-132 :

3,70 (3H, s), 3,82 (3H, s), 6,83 (1H, s), 7,11 (2H, s), 7,54 (1H, q), 8,62 (1H, d), 8,70 (1H, dd)

5 Composto No. VIII-133 :

3,87(6H, s), 3,97(3H, s), 6,51(2H, s), 7,56(1H, q), 8,63(1H, m), 8,76(1H, m)

Composto No. VIII-134 :

7,16 (1H, dd), 7,30 (2H, m), 7,61-7,69 (3H, m), 8,71 (1H, q)

10 Composto No. VIII-135 :

3,91 (3H, s), 7,12-7,24 (5H, m), 8,70 (1H, q)

Composto No. VIII-136 :

7,29-7,32 (2H, m), 7,53 (1H, d), 7,59-7,69 (3H, m), 8,54 (1H,

d)

15 Composto No. VIII-137 :

3,92 (3H, s), 7,13 (2H, d), 7,21 (2H, d), 7,52 (1H, d), 8,53 (1H,

d)

Composto No. VIII-139 :

3,73 (3H, s), 3,91 (3H, s), 6,93 (1H, d), 7,10 (2H, d), 7,23 (2H,

20 d), 8,39 (1H, d)

Composto No. VIII-142 :

7,52 (1H, t), 7,61 (1H, m), 7,70 (1H, d), 7,91 (1H, m), 8,67

(2H, m)

Composto No. VIII-143 :

25 7,56 (4H, m), 8,67 (2H, m)

Composto No. VIII-144 :

7,59 (3H, m), 7,90 (1H, t), 8,67 (2H, m)

Composto No. VIII-145 :

7,31 (1H, d), 7,44 (1H, s), 7,61 (2H, m), 8,65 (2H, m)

Composto No. VIII-150 :

2,37 (3H, s), 2,39 (3H, s), 7,07 (2H, m), 7,42 (1H, d), 7,55 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,72 (1H, m)

Composto No. VIII-152 :

5 7,62 (1H, q), 7,85 (2H, s), 8,12 (1H, s), 8,65-8,68 (2H, m)

Composto No. VIII-153 :

3,73 (6H, s), 6,80 (2H, d), 7,47-7,53 (2H, m), 8,54 (1H, dd), 8,64 (1H, dd)

Composto No. VIII-154 :

10 7,29-7,45 (2H, m), 7,54-7,69 (2H, m), 8,60-8,68 (2H, m)

Composto No. VIII-155 :

7,30 (1H, t), 7,42 (2H, d), 7,59 (1H, q), 8,64 (1H, d), 8,68 (1H, d)

Composto No. VIII-156 :

15 7,30-7,46 (2H, m), 7,56-7,66 (2H, m), 8,64 (1H, dd), 8,69 (1H, d)

Composto No. VIII-157 :

7,11 (1H, d), 7,19 (1H, dd), 7,60 (1H, q), 7,69 (1H, t), 8,65 (1H, d), 8,69 (1H, d)

Composto No. VIII-158 :

20 7,28-7,37 (1H, m), 7,38-7,45 (2H, m), 7,59 (1H, m), 8,62-8,68 (2H, m)

Composto No. VIII-159 :

25 7,22-7,26 (1H, m), 7,40-7,45 (2H, m), 7,59 (1H, dd), 8,62-8,71 (1H, m)

Composto No. VIII-160 :

2,41 (3H, d), 7,18 (1H, t), 7,32 (1H, t), 7,47 (1H, t), 7,58 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,70 (1H, dd)

Composto No. VIII-161 :

2,51 (3H, s), 7,18-7,29 (3H, m), 7,55-7,60 (1H, m), 8,63 (1H, d), 8,71 (1H, d), 13,35 (1H, br)

Composto No. VIII-162 :

2,45 (3H, s), 7,16 (1H, dd), 7,27 (1H, t), 7,38-7,43 (1H, m),
5 7,58 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,71 (1H, dd)

Composto No. VIII-163 :

1,94 (3H, d), 7,01 (1H, d), 7,31 (1H, t), 7,43 (1H, q), 7,59 (1H, q), 8,67 (1H, dd), 8,70 (1H, dd)

Composto No. VIII-164 :

10 2,41(3H, d), 7,02(2H, d), 7,48(1H, t), 7,57(1H, q), 8,63(1H,m),
8,70(1H,m)

Composto No. VIII-165 :

2,48 (3H, s), 6,88 (1H, d), 6,94 (1H, s), 7,15 (1H, d), 7,58 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,72 (1H, dd)

15 Composto No. VIII-166 :

7,12-7,18 (3H, m), 7,59 (1H, q), 8,64-8,72 (2H, m), 11,85 (1H, br)

Composto No. VIII-167 :

20 7,11-7,19 (2H, m), 7,26-7,31 (1H, m), 7,58 (1H, dd), 8,64 (1H, dd), 8,72 (1H, dd), 13,22 (1H, br)

Composto No. VIII-168 :

1,99 (3H, s), 6,95 (1H, dd), 7,22-7,28 (1H, m), 7,46 (1H, q), 7,59 (1H, q), 8,66 (1H, dd), 8,71 (1H, dd)

Composto No. VIII-169 :

25 7,59-7,72 (4H, m), 8,62-8,68 (2H, m), 9,57 (1H, br)

Composto No. VIII-170 :

7,26-7,30 (2H, d), 7,62 (1H, dd), 7,91 (1H, t), 8,64-8,70 (2H, m), 12,16 (1H, br)

Composto No. VIII-171 :

7,37-7,41 (1H, m), 7,52-7,60 (2H, m), 7,65-7,69 (1H, m),
8,62-8,65 (2H, m), 13,20 (1H, br)

Composto No. VIII-172 :

3,87 (3H, d), 7,05 (1H, d), 7,22-7,28 (1H, m), 7,35-7,40 (1H,
5 m), 7,57 (1H, q), 8,64 (1H, dd), 8,69 (1H, dd)

Composto No. VIII-173 :

3,75 (1H, s), 6,88-6,95 (2H, m), 7,21-7,27 (1H, m), 7,56 (1H,
dd), 8,63 (1H, dd), 8,69 (1H, dd), 13,67 (1H, br)

Composto No. VIII-174 :

10 3,73 (3H, s), 7,05 (1H, dd), 7,12 (1H, dd), 7,28-7,34 (1H, m),
7,56 (1H, q), 8,62 (1H, dd), 8,68 (1H, dd)

Composto No. VIII-175 :

6,65 (1H, t), 7,20 (2H, m), 7,39 (1H, t), 7,59 (1H, q), 8,68 (2H,
m)

15 Composto No. VIII-176 :

6,69 (1H, t), 7,14 (1H, m), 7,22 (1H, m), 7,52 (1H, t), 7,59
(1H, q), 8,63 (1H, m), 8,69 (1H, m)

Composto No. VIII-177 :

20 6,42 (1H, t), 7,18-7,25 (2H, m), 7,37-7,42 (1H, m), 7,59 (1H,
m), 8,62-8,68 (2H, m), 12,34 (1H, br)

Composto No. VIII-178 :

7,51 (1H, t), 7,60-7,67 (3H, m), 8,65 (2H, d)

Composto No. VIII-179 :

25 2,49 (3H, s), 7,23 (1H, d), 7,36 (1H, m), 7,52 (1H, s), 7,57
(1H, q), 8,66 (2H, m)

Composto No. VIII-180 :

2,51 (3H, s), 7,14 (1H, d), 7,34 (1H, s), 7,56 (2H, m), 8,63
(1H, d), 8,70 (1H, m)

Composto No. VIII-181 :

6,67 (1H, t), 7,25 (2H, m), 7,50 (2H, m), 7,59 (1H, q), 8,68 (2H, m)

Composto No. VIII-182 :

2,64 (3H, s), 7,42 (1H, d), 7,60 (3H, t), 8,65 (1H, d), 8,70 (1H,

5 t)

Composto No. VIII-183 :

2,49 (3H, s), 3,73(3H, s), 6,98 (1H, s), 7,02 (1H, d), 7,13 (1H, d), 7,53 (1H, q), 8,62 (1H, dd), 8,70 (1H, dd)

Composto No. VIII-184 :

10 2,68 (3H, s), 7,29 (1H, dd), 7,33 (1H, s), 7,60 (1H, q), 7,89 (1H, d), 8,65 (1H, dd), 8,68 (1H, dd)

Composto No. VIII-185 :

2,70 (3H, s), 7,47 (1H, dd), 7,58-7,63 (3H, m), 8,65 (1H, dd), 8,68 (1H, dd)

15 Composto No. VIII-187 :

6,96(6H, m), 7,24(1H, m), 7,62(1H, q), 8,66(2H, m)

Composto No. VIII-190 :

2,45(3H, s), 7,04(1H, t), 7,22(1H, t), 7,59(1H, q), 8,63(1H, m), 8,69(1H, m)

20 Composto No. VIII-192 :

4,14 (3H, s), 6,93 (2H, m), 7,59 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,70 (1H, m)

Composto No. VIII-193 :

25 2,36 (3H, s), 7,20 (1H, d), 7,36 (1H, d), 7,59 (1H, q), 8,63 (1H, m), 8,69 (1H, m)

Composto No. VIII-194 :

7,30 (2H, dd), 7,60-7,71 (3H, m), 8,61 (2H, q)

Composto No. VIII-195 :

2,56 (3H, s), 7,30 (2H, d), 7,40 (1H, d), 7,58-7,66 (3H, m),

8,47 (1H, d)

Composto No. VIII-196 :

2,53 (3H, s), 7,31 (2H, m), 7,65 (3H, m), 8,40 (1H, s), 8,52 (1H, s)

5

Composto No. VIII-197 :

2,92 (3H, s), 7,30 (2H, d), 7,38 (1H, d), 7,59-7,68 (3H, m), 8,51 (1H, d)

Composto No. VIII-198 :

2,48 (3H, s), 2,92 (3H, s), 7,10 (2H, d), 7,40 (2H, q), 7,54 (1H, t), 8,53 (1H, d)

10

Composto No. VIII-199 :

2,91 (3H, s), 7,40 (1H, d), 7,52 (1H, d), 7,60 (1H, s), 7,79 (1H, t), 7,87 (1H, d), 8,49 (1H, d)

Composto No. VIII-200 :

2,91 (3H, s), 3,90 (3H, s), 7,14 (2H, d), 7,22 (2H, d), 7,37 (1H, d), 8,54 (1H, d)

15

Composto No. VIII-201 :

2,40 (3H, d), 2,91 (3H, s), 7,00 (2H, d), 7,39 (1H, d), 7,46 (1H, d), 8,52 (1H, d)

20

Composto No. VIII-202 :

2,91 (3H, s), 3,99 (3H, s), 7,04-7,09 (2H, m), 7,17 (1H, t), 7,39 (1H, d), 8,53 (1H, d)

Composto No. VIII-203 :

4,17 (3H, s), 6,95 (1H, d), 7,28-7,32 (2H, m), 7,58-7,69 (3H, m), 8,51 (1H, d)

25

Composto No. VIII-204 :

4,18 (3H, s), 6,97 (1H, d), 7,52 (1H, d), 7,60 (1H, s), 7,81 (1H, t), 7,87 (1H, d), 8,48 (1H, d)

Composto No. VIII-208 :

2,41 (3H, d), 2,53 (3H, s), 7,02 (2H, d), 7,47 (1H, t), 8,40 (1H, q), 8,53 (1H, d)

Composto No. VIII-209 :

2,42 (3H, d), 2,59 (3H, s), 7,00 (2H, d), 7,43 (2H, q), 8,46 (1H, d)

Composto No. VIII-210 :

7,30 (2H, d), 7,61-7,70 (4H, m), 8,53 (1H, d)

Composto No. VIII-211 :

2,41 (3H, s), 3,74 (3H, s), 6,94 (1H, d), 7,02 (2H, m), 7,43 (1H, t), 8,40 (1H, d)

Composto No. VIII-212 :

1,44 (3H, t), 4,08 (2H, q), 6,82 (1H, s), 6,87 (1H, d), 7,13 (1H, d), 7,53-7,58 (2H, m), 8,63 (1H, d), 8,72 (1H, d)

Composto No. VIII-213 :

1,48 (3H, t), 4,13 (2H, q), 7,15 (2H, d), 7,23 (2H, d), 7,56 (1H, m), 8,63 (1H, d), 8,72 (1H, d)

Composto No. VIII-214 :

3,91 (3H, s), 7,12 (2H, d), 7,21 (2H, d), 7,59 (1H, d), 8,55 (1H, d)

Composto No. VIII-215 :

2,15 (3H, s), 7,31-7,36 (3H, m), 7,59-7,66 (3H, m), 8,27 (1H, d)

Composto No. VIII-216 :

3,77 (3H, s), 4,35 (4H, s), 6,77 (1H, dd), 6,85 (1H, d), 6,93 (1H, d), 7,05 (1H, d), 8,39 (1H, d)

Composto No. VIII-218 :

6,13 (2H, s), 6,72-6,77 (2H, m), 7,03 (1H, d), 7,61 (1H, d), 8,57 (1H, d)

Para os intermediários de produção obtidos no exemplo 7 e

exemplo 8, bem como um intermediário produzido da mesma maneira, os dados de RMN-¹H (valor CDCl₃/TMS δ (ppm)) estão apresentados a seguir.

Composto No. X-1 :

6,77 (1H, d), 7,29-7,67 (7H, m), 8,06 (d, 1H)

5

Composto No. X-6 :

6,78 (1H, d), 7,21-7,62 (6H, m), 8,06 (1H, d)

Composto No. X-7 :

6,77 (1H, d), 7,26 (2H, d), 7,45 (1H, t), 7,55-7,63 (3H, m),
8,09 (1H, d)

10

Composto No. X-9 :

2,48 (1H, s), 6,80 (1H, d), 7,17 (2H, d), 7,39-7,45 (3H, m),
7,54 (1H, t), 8,04 (1H, d)

Composto No. X-12 :

1,29 (d, 6H), 3,00 (1H, m), 6,77 (1H, d), 7,09-7,14 (2H, m),
15 7,40-7,46 (2H, m), 7,52-7,57 (2H, m), 8,05 (1H, d)

Composto No. X-14 :

6,71 (1H, d), 7,45-7,62 (4H, m), 7,78-7,89 (2H, m), 8,09 (1H,
d)

Composto No. X-17 :

20 3,74 (3H, s), 6,74 (1H, d), 7,14-7,24 (3H, m), 7,41 (1H, t),
7,51-7,58 (2H, m), 8,05 (1H, d)

Composto No. X-18 :

3,84 (3H, s), 6,80-6,89 (3H, m), 7,12 (1H, d), 7,43 (1H, t),
7,49-7,61 (2H, m), 8,05 (1H, d)

25

Composto No. X-20 :

1,43 (3H, t), 4,06 (2H, m), 6,79 (3H, m), 7,11 (1H, d), 7,40-
7,58 (3H, m), 8,04 (1H, d)

Composto No. X-21 :

1,48 (3H, t), 4,12 (2H, q), 6,83 (1H, d), 7,10 (2H, d), 7,19 (2H,

d), 7,44 (1H, t), 7,54 (1H, t), 8,04 (1H, d)

Composto No. X-29 :

6,75 (1H, d), 7,22-7,29 (2H, m), 7,56-7,72 (4H, m), 8,08 (1H, d)

5 Composto No. X-43 :

3,91 (3H, s), 6,80-6,88 (3H, m), 7,46 (1H, t), 7,55-7,64 (2H, m), 8,07 (1H, d)

Composto No. X-44 :

2,31 (3H, s), 3,82 (3H, s), 6,70 (3H, s), 6,76-6,85 (2H, m),
10 7,35-7,57 (3H, m), 8,04 (1H, d)

Composto No. X-45 :

3,87 (3H, s), 3,98 (3H, s), 6,76 (1H, d), 6,85 (1H, dd), 7,07 (1H, d), 7,43 (1H, t), 7,56 (1H, t), 8,05 (1H, d)

Composto No. X-46 :

15 3,82 (6H, s), 6,42 (2H, s), 6,64 (1H, s), 6,87 (1H, d), 7,43 (1H, t), 7,57 (1H, t), 8,04 (1H, d)

Composto No. X-53 :

3,85 (6H, s), 3,94 (3H, s), 6,50 (2H, s), 6,86 (1H, d), 7,45 (1H, t), 7,59 (1H, t), 8,05 (1H, d)

20 Composto No. IX-6 :

1,01 (3H, t), 1,47 (2H, m), 1,78 (2H, m), 4,32 (2H, m), 7,39-7,53 (2H, m), 7,76 (1H, t), 8,03 (1H, d)

Composto No. IX-9 :

0,90 (3H, t), 1,30-1,51 (6H, m), 1,78 (2H, m), 4,29 (2H, t),
25 7,40-7,47 (2H, m), 7,75 (1H, t), 8,04 (1H, d)

Composto No. IX-28 :

2,28 (3H, s), 2,85 (2H, t), 4,51 (2H, t), 7,41-7,70 (2H, m), 7,79 (1H, t), 8,12 (1H, d)

Composto No. IX-29 :

3,09 (3H, s), 3,49 (2H, t), 4,77 (2H, t), 7,50-7,58 (2H, m), 7,84 (1H, t), 8,08 (1H, d)

Composto No. IX-73 :

6,12 (2H, d), 6,74-6,76 (2H, m), 6,88 (1H, d), 7,01 (1H, d),
5 7,43 (1H, t), 7,57 (1H, t), 8,04 (1H, d)

Composto No. IX-75 :

4,33 (4H, s), 6,74-6,89 (3H, m), 7,08 (1H, d), 7,44 (1H, t),
7,55 (1H, t), 8,02 (1H, d)

10 Daqui em diante, métodos de preparação serão descritos em detalhe com referência aos exemplos de preparação representativos. O tipo dos compostos e aditivos, e as razões de incorporação podem ser alteradas em uma ampla faixa, sem se limitar aos dados a seguir. Na seguinte descrição, a “parte” significa partes em peso.

<Exemplo de preparação 1> Formulação de pó umectável

15	Composto do composto No. I-12	10 partes
	Octil fenil éter de polioxietileno	0,5 partes
	Sal de sódio de ácido	
	β -naftalenossulfônico-condensado	
	de formalina	0,5 partes
20	Terra de diatomácea	20 partes
	Argila	69 partes

Os componentes mencionados anteriormente foram uniformemente misturados e pulverizados para obter um formulação de pó umectável. Além disso, formulações de pó umectáveis podem ser obtidas da
25 mesma maneira, usando os respectivos compostos descritos na tabela 1 a tabela 45 em vez do composto do composto No. I-12.

<Exemplo de preparação 2> Formulação escoável

Composto do composto No. I-13	20 partes
Água	69 partes

Sulfato de fenil éter de polioxietileno

estirenado 4 partes

Etileno glicol 7 partes

Aos componentes mencionados anteriormente, silicone AF-118N (fabricado por Asahi Kasei Corp.) foi adicionado em uma quantidade de 200 ppm com base na quantidade total, e a mistura foi misturada por 30 minutos em um agitador de alta velocidade, e pulverizado em um pulverizador tipo úmido, para obter uma formulação escoável. Além disso, formulações escoáveis podem ser obtidas da mesma maneira, usando os respectivos compostos descritos na tabela 1 a tabela 45 em vez do composto do composto No. I-13.

<Exemplo de preparação 3> Concentrado emulsificável

Composto do composto No. I-59	30 partes
Mistura de quantidades iguais de	
xileno e isoforona	60 partes
Polioxietileno sorbitano alquilado	4 partes
Polialquilaril éter de polioxietileno	4 partes
Alquilarila sulfonado	2 partes

Os componentes mencionados anteriormente foram dissolvidos uniformemente para obter um concentrado emulsificável. Além disso, emulsões podem ser obtidas da mesma maneira, usando os respectivos compostos descritos na tabela 1 a tabela 45 em vez do composto do composto No. I-59.

<Exemplo de preparação 4> Formulação de grânulo

Composto do composto No. I-58	10 partes
Mistura de talco e bentonita (1:3)	80 partes
Carbão branco	5 partes
Polioxietileno sorbitano alquilado	2 partes
Polialquilaril éter de polioxietileno	2 partes

Alquilarila sulfonada

1 parte

Os componentes mencionados anteriormente foram uniformemente misturados e pulverizados. A esta mistura, água foi adicionada em uma quantidade equivalente a 10 partes, e a mistura resultante foi misturada. A mistura misturada foi extrusada por meio de um orifício tendo um diâmetro de 0,7 mm usando um granulador tipo extrusão, seca e então cortada em um comprimento de 0,5 a 1 mm, para obter uma formulação granular. Além disso, formulações de grânulo podem ser obtidas da mesma maneira, usando os respectivos compostos descritos na tabela 1 a Tabela 45 em vez do composto do composto No. I-58.

Os compostos descritos nas tabelas 1 a 45 podem ser formulados em várias formulações da mesma maneira de acordo com os métodos descritos nos exemplos de preparação 1 a 4.

Daqui em diante, a atividade herbicida do composto da presente invenção será descrita com referência aos exemplos de teste.

<Exemplo de teste 1> Teste para efeitos herbicidas no tratamento de solo de campo de arroz.

Um pote plástico de 100 cm² foi carregado com solo de campo de arroz. Depois de regadas e do nivelamento as sementes de *Echinochloa oryzicola* Vasing, *Monochoria vaginalis* (Burm. f.) Presl var. *plantaginea* (Roxb.) Solms-Laub., e *Scirpus juncoide*s Roxb. var. *ohwianus*. T. Koyama foram semeadas e o solo foi encharcado a uma profundidade de água de 3 cm. No dia seguinte, uma formulação de pó umectável preparada de acordo com o exemplo de preparação 1 foi diluída com água, e foi adicionada em gotas na superfície. A quantidade de aplicação foi uma quantidade equivalente a 1.000 g do ingrediente ativo por hectare. Daí em diante, as plantas cresceram em uma estufa e no 21º dia depois do tratamento, os efeitos herbicidas foram investigados de acordo com os critérios descritos na tabela 138.

Tabela 138

Índice No.	Efeitos herbicidas (do grau de supressão do crescimento) e fitotoxicidade
5	90% ou mais efeitos herbicidas de supressão, fitotoxicidade
4	70% ou mais e menos que 90% de efeitos herbicidas, fitotoxicidade
3	50% ou mais e menos que 70% de efeitos herbicidas, fitotoxicidade
2	30% ou mais e menos que 50% de efeitos herbicidas, fitotoxicidade
1	10% ou mais e menos que 30% de efeitos herbicidas, fitotoxicidade
0	0% ou mais e menos que 10% de efeitos herbicidas, fitotoxicidade

Os resultados são apresentados na seguinte tabela 139 a tabela

146.

Tabela 139

Composto No.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
I-2	4	5	5
I-7	5	5	5
I-12	5	5	5
I-13	5	5	5
I-14	4	5	5
I-15	5	5	5
I-22	5	5	5
I-30	5	5	5
I-35	5	5	5
I-40	5	5	5
I-49	5	5	5
I-50	5	5	5
I-57	4	5	5
I-58	5	5	5
I-59	5	5	5
I-62	5	5	5
I-65	4	5	5
I-67	4	5	5
I-68	4	5	5
I-70	5	5	5
I-72	5	5	5
I-82	5	5	5
I-88	5	5	5
I-90	5	5	5
I-91	5	5	5
I-92	4	5	5
I-93	5	5	5
I-94	5	5	5
I-99	5	5	5
I-102	5	4	5
I-103	5	5	5
I-107	4	5	5
I-111	5	5	5
I-112	5	5	5
I-113	5	5	5
I-120	4	5	5
I-125	4	5	5
I-126	4	5	5
I-131	5	5	5
I-137	5	5	5
I-139	5	5	5
I-144	5	5	5
I-145	5	5	5
I-148	5	5	5
I-149	5	5	4
I-156	5	5	5
I-158	5	5	5
I-159	5	5	5
I-160	5	5	5
I-163	4	5	5

Tabela 140

Composto No.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
I-165	5	5	5
I-166	4	5	5
I-171	5	5	5
I-173	5	5	5
I-176	5	5	5
I-177	5	5	5
I-178	4	5	5
I-179	5	5	5
I-180	4	5	5
I-182	5	5	5
I-185	5	5	5
I-189	5	5	5
I-197	5	5	5
I-199	5	5	5
I-201	5	5	5
I-202	5	5	5
I-207	4	5	5
I-209	4	5	5
I-211	4	5	5
I-212	5	5	5
I-213	4	5	5
I-220	5	5	5
I-221	5	5	5
I-223	4	5	5
I-225	5	5	4
I-227	5	5	5
I-229	4	5	5
I-230	5	5	5
I-238	5	4	5
I-263	5	5	5
I-264	4	5	5
I-265	4	5	5
I-266	5	5	5
I-267	5	5	5
I-268	5	5	5
I-269	5	5	5
I-270	5	5	5
I-271	5	5	5
I-272	5	5	5
I-273	5	5	5
I-274	5	5	4
I-275	4	5	5
I-276	5	5	5
I-277	5	5	5
I-278	4	5	5
I-279	4	5	5
I-280	5	5	5
I-281	5	5	5
I-283	4	5	5
I-363	5	5	5
I-364	4	5	5
I-368	4	5	5
I-371	5	5	5
I-372	5	5	5
I-373	5	5	5
I-379	5	5	5
I-380	4	5	5

Tabela 141

Composto No.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> T. Koyama
II-1	5	5	5
II-4	5	5	5
II-5	5	5	5
II-6	5	5	5
II-7	5	5	5
II-8	5	5	5
II-9	5	5	5
II-11	5	5	5
II-13	5	5	5
II-14	5	5	5
II-15	5	5	5
II-20	5	5	5
II-21	5	5	5
II-23	5	5	5
II-24	5	5	5
II-29	5	5	5
II-33	5	5	5
II-39	5	5	5
II-44	5	5	5
II-51	5	5	5
II-52	5	5	5
II-57	5	5	5
II-62	5	5	5
II-63	5	5	5
II-64	5	5	4
II-68	5	5	5
II-69	5	5	5
II-71	4	5	5
II-74	5	5	5
II-75	5	5	5
II-81	5	5	5
II-84	5	5	5
II-90	5	5	5
II-95	5	5	5
II-101	5	5	5
II-116	5	5	5
II-121	4	5	5
II-122	5	5	5
II-124	4	5	5
II-125	5	5	5
II-129	5	5	5
II-130	5	5	5
II-131	5	5	5
II-136	5	5	5
II 13 7	5	5	5
II-140	5	5	4
II-149	5	5	5
II-167	5	5	5
II-168	5	5	5
II-169	5	5	5

Tabela 142

Composto No.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
II-173	5	5	5
II-174	5	5	5
II-175	4	5	5
II-177	4	5	5
II-178	4	5	5
II-179	4	5	5
II-180	5	5	5
II-185	4	5	5
II-186	4	5	5
II-187	5	5	5
II-188	5	5	5
II-189	5	5	5
II-190	5	5	5
II-193	5	5	5
II-194	4	5	5
II-195	5	5	5
II-196	4	5	5
II-197	5	5	5
II-208	5	5	5
II-209	5	5	5
II-210	5	5	5
II-211	5	5	5
II-212	5	5	5
II-213	5	5	5
II-214	5	5	5
II-215	5	5	5
II-216	5	5	5
II-217	4	5	5
II-218	4	5	5
II-219	5	5	5
II-220	5	5	5
II-221	4	5	5
II-222	5	5	5
II-223	5	5	5
II-224	4	5	5
II-225	5	5	5
II-226	5	5	5
II-227	5	5	5
II-228	5	5	5
II-229	5	5	5
II-230	4	5	5
II-231	5	5	5
II-232	4	5	5
II-233	5	5	5
II-235	4	5	5
II-236	4	5	5
II-237	5	5	5
II-238	5	5	5
II-239	5	5	5

Tabela 143

Composto No.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> T. Koyama
II-240	4	5	5
II-241	5	5	5
II-242	5	5	5
II-243	5	5	5
II-244	5	5	5
II-245	5	5	5
II-246	4	5	5
II-247	4	5	5
II-248	5	5	5
II-249	5	5	5
II-252	5	5	5
II-253	5	5	5
II-254	5	5	5
II-255	5	5	5
II-256	5	5	5
II-257	5	5	5
II-258	4	5	5
II-259	4	5	5
II-260	5	5	5
II-261	5	5	5
II-263	5	5	5
II-301	5	5	5
II-303	5	5	5
II-304	5	5	5
II-305	5	5	5
II-306	5	5	5
III-2	5	5	5
III-5	5	5	5
III-7	5	5	5
III-12	5	5	5
III-13	5	5	5
III-15	5	5	5
III-30	4	5	5
III-35	4	5	5
III-40	5	5	5
III-45	4	5	5
III-59	5	5	5
III-70	4	5	5
III-88	5	5	4
III-90	5	5	5
III-96	5	5	5
III-99	5	5	5
III-107	5	5	5
III-108	5	5	5
III-111	5	5	5
III-117	5	5	5
III-118	5	5	5
III-120	5	5	5
III-130	5	5	5
III-139	5	5	5
III-158	5	5	5
III-173	5	5	5
III-189	5	5	5
III-201	5	5	5

Tabela 144

Composto No.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncooides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
III-202	5	5	5
III-207	5	5	5
III-209	5	5	5
III-212	4	5	5
III-213	4	5	5
III-220	5	5	5
III-221	4	5	5
III-229	5	5	5
III-230	5	5	5
III-231	5	5	5
III-232	5	5	5
III-234	5	5	5
III-235	5	5	5
III-236	5	5	5
III-237	5	5	5
III-238	4	5	5
III-239	4	5	5
III-240	4	5	5
III-241	5	5	5
III-242	5	5	5
III-243	5	5	5
III-244	4	5	5
III-245	4	5	5
III-246	5	5	5
III-247	5	5	5
IV-1	5	5	5
IV-2	5	5	5
IV-3	5	5	5
IV-4	5	5	5
IV-6	4	5	5
IV-7	5	5	5
IV-8	5	5	5
IV-9	5	5	5
IV-11	5	5	5
IV-13	5	5	5
IV-17	5	5	5
IV-18	5	5	5
IV-19	5	5	5
IV-20	5	5	5
IV-21	5	5	5
IV-23	5	5	5
IV-24	5	5	5
IV-30	5	5	5
IV-33	5	5	5
IV-34	5	5	5
IV-39	5	5	5
IV-40	5	5	5
IV-41	5	5	5
IV-44	5	5	5

Tabela 145

Composto No.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
IV-52	5	5	5
IV-57	4	5	5
IV-62	5	5	5
IV-85	5	5	5
IV-90	5	5	5
IV-95	5	5	5
IV-100	5	5	5
IV-101	5	5	5
IV-106	5	5	5
IV-128	5	5	5
IV-136	5	5	5
IV-150	5	5	5
IV-151	5	5	5
IV-152	5	5	5
IV-153	5	5	5
IV-154	5	5	5
IV-155	5	5	5
IV-156	5	5	5
IV-157	5	5	5
IV-158	5	5	5
IV-159	5	5	5
IV-160	5	5	5
IV-161	5	5	5
IV-165	4	5	5
IV-166	5	5	5
IV-168	5	5	5
IV-169	4	5	5
IV-170	5	5	5
IV-173	4	5	5
IV-174	5	5	5
IV-177	5	5	5
IV-178	5	5	5
IV-179	5	5	5
IV-180	5	5	5
IV-184	5	5	5
IV-185	5	5	5
IV-186	5	5	5
IV-187	5	5	5
IV-188	5	5	5
IV-189	5	5	5
IV-200	5	5	5
IV-201	5	5	5
IV-202	5	5	5
IV-203	5	5	5
IV-206	5	5	5
IV-208	5	5	5
IV-209	5	5	5
IV-210	5	5	5
IV-212	5	5	5
IV-213	5	5	5
IV-214	5	5	5

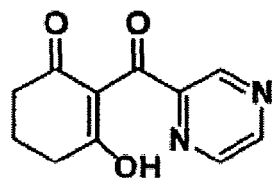
Tabela 146

Composto No.	<i>Echinochloa oryzicola</i> Vasing	<i>Monochoria vaginalis</i> (Burm. f.) Presl var. <i>plantaginea</i> (Roxb.) Solms-Laub.	<i>Scirpus juncoides</i> Roxb. var. <i>ohwianus</i> . T. Koyama
IV-215	5	5	5
IV-216	5	5	5
IV-217	5	5	5
IV-218	5	5	5
IV-219	5	5	5
IV-220	5	5	5
IV-221	5	5	5
IV-222	5	5	5
IV-223	5	5	5
IV-224	5	5	5
IV-225	5	5	5
IV-226	5	5	5
IV-227	5	5	5
IV-228	5	5	5
IV-229	5	5	5
IV-230	5	5	5
IV-231	5	5	5
IV-232	5	5	5
IV-233	5	5	5
IV-234	5	5	5
IV-235	5	5	5
IV-236	5	5	5
IV-237	5	5	5
IV-238	5	5	5
IV-239	5	5	5
IV-240	5	5	5
IV-241	5	5	5
IV-242	4	5	5
IV-243	5	5	5
IV-244	5	5	5
IV-245	5	5	5
IV-247	5	5	5
IV-248	5	5	5
IV-249	5	5	5
IV-250	3	5	5
IV-251	5	5	5
IV-252	5	5	5
IV-253	5	5	5
IV-254	5	5	5
IV-255	5	5	5
IV-256	5	5	5
IV-257	5	5	5
IV-258	5	5	5
IV-259	5	5	5
IV-260	5	5	5
IV-262	4	5	5
IV-265	5	5	5
IV-266	5	5	5
IV-267	5	5	5
IV-268	5	5	5
IV-269	5	5	5
IV-270	5	5	5
IV-271	5	5	5
Composto Comparativo A	2	0	0
Composto Comparativo B	0	0	0
Composto Comparativo C	1	2	1
Composto Comparativo D	1	4	2

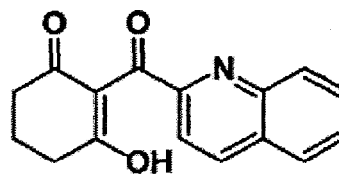
Adicionalmente, composto comparativo A, composto

comparativo B, composto comparativo C e composto comparativo D nas tabelas são Composto No. 70, Composto No. 34, Composto No. 32 e Composto No. 31 descritos em EP 283261, respectivamente. As fórmulas estruturais destes compostos são mostradas a seguir.

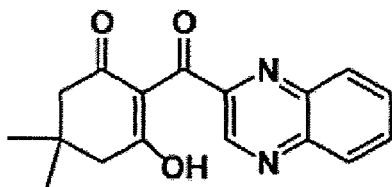
[Fórmula química 35]



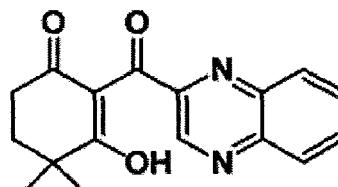
Composto Comparativo A



Composto Comparativo B



Composto Comparativo C



Composto Comparativo D

5 <Exemplo de teste 2> Teste dos efeitos herbicidas no
tratamento do solo de campo de planície

Um pote plástico de 80 cm² foi carregado com solo de campo de planície. Sementes de *Abutilon theophrasti medicus* e *Amaranthus viridis* L. foram semeadas, e solo foi coberto. Uma formulação de pó umectável preparada de acordo com o exemplo de preparação 1 foi diluída com água, e
10 foi uniformemente aspergida na superfície do solo com um aspersor pequeno, em uma quantidade equivalente a 1.000 litros por hectare, de maneira tal que 1.000 g do ingrediente ativo por hectare fossem aplicadas. Daí em diante, as plantas cresceram em uma estufa e no 21º dia depois do tratamento, os efeitos
15 herbicidas foram investigados de acordo com os critérios descritos na tabela 138 mostrada a anteriormente. Os resultados são apresentados na seguinte tabela 147 a tabela 154.

Tabela 147

Composto No.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
I-2	5	5
I-5	5	5
I-7	5	5
I-12	5	5
I-13	5	5
I-14	5	5
I-15	5	5
I-18	5	5
I-21	5	5
I-30	5	5
I-40	5	5
I-49	5	5
I-50	5	5
I-57	4	5
I-58	5	5
I-59	5	5
I-62	5	5
I-65	5	5
I-68	5	5
I-70	5	5
I-71	5	5
I-72	5	5
I-80	5	5
I-82	5	5
I-88	5	5
I-90	5	5
I-93	4	5
I-94	5	4
I-99	5	5
I-102	5	5
I-103	5	5
I-107	5	5
I-131	5	5
I-139	5	5
I-144	5	5
I-145	5	5
I-148	5	5
I-149	5	5
I-156	5	5
I-158	5	5
I-159	5	5
I-160	5	5
I-163	5	5
I-165	5	5
I-171	5	5
I-173	5	5
I-176	5	5
I-177	5	5
I-178	5	5
I-179	5	5

Tabela 148

Composto No.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
I-180	5	5
I-182	5	5
I-185	5	5
I-189	5	5
I-195	5	5
I-197	5	5
I-199	5	5
I-201	4	5
I-202	4	5
I-207	5	5
I-209	4	5
I-211	5	5
I-212	5	5
I-213	5	5
I-220	5	5
I-221	5	5
I-223	5	5
I-225	5	5
I-227	5	5
I-229	5	5
I-230	4	5
I-238	5	4
I-256	5	5
I-263	5	5
I-264	4	5
I-265	4	5
I-266	5	5
I-267	5	5
I-268	5	5
I-269	5	5
I-270	5	5
I-271	5	5
I-272	5	5
I-273	5	5
I-275	4	5
I-277	4	5
I-278	5	5
I-279	5	5
I-281	5	5
I-283	5	5
I-363	5	5
I-364	5	5
I-368	5	5
I-371	5	5
I-372	5	5
I-373	5	5
I-379	5	5
I-380	5	5
II-1	5	5
II-4	4	5
II 5	5	V
II-6	5	5
II-7	5	5
II-8	5	5
II-9	5	4
II-11	5	5

Tabela 149

Composto No.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
II-13	5	5
II-14	5	5
II-15	5	5
II-20	5	5
II-21	5	5
II-23	5	5
II-24	5	5
II-29	4	5
II-33	4	5
II-39	5	5
II-44	5	5
II-52	5	5
II-57	5	5
II-62	5	5
II-63	5	5
II-64	4	5
II- 68	5	5
II-69	4	5
II-75	4	5
II-81	5	5
II-90	5	5
II-95	5	5
II-101	5	5
II-122	5	5
II-125	5	5
II-129	5	5
II-130	5	5
II-131	5	5
II-136	5	5
II-137	5	5
II-146	4	5
II-149	4	5
II-167	5	5
II-168	5	5
II-173	4	5
II-174	4	5
II-180	4	5
II-185	5	5
II-186	5	5
II-188	5	5
II-189	5	5
II-190	5	4
II-193	5	5
II-194	4	5
II-196	4	5
II-208	5	5
II-211	5	5
II-212	5	5
II-213	5	5

Tabela 150

Composto No.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
II-215	5	5
II-216	4	5
II-217	5	5
II-218	5	5
II-219	5	5
II-220	5	5
II-221	4	5
II-222	5	5
II-223	4	5
II-224	5	5
II-225	5	5
II-226	5	5
II-227	5	5
II-228	5	5
II-229	4	5
II-230	4	5
II-231	4	5
II-232	4	5
II-233	5	5
II-234	5	5
II-235	4	5
II-236	4	5
II-237	5	5
II-238	5	5
II-239	5	5
II-240	5	5
II-241	5	5
II-242	4	5
II-243	5	5
II-244	5	5
II-245	5	5
II-247	5	5
II-249	5	5
II-250	5	5
II-252	5	5
II-254	4	5
II-259	5	5
II-260	5	5
II-261	4	5
II-262	4	5
II-263	4	5
II-301	5	5
II-302	4	5
II-303	5	5
II-304	5	5
II-305	5	5
II-306	5	5
III-2	5	5
III-5	5	4
III-7	5	5
III-12	4	5
III-13	5	5
III-15	5	5
III-30	5	5

Tabela 151

Composto No.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
III-35	5	5
III-40	5	5
III-45	4	5
III-59	5	5
III-70	5	5
III-88	5	5
III-90	5	5
III-96	5	5
III-99	5	5
III-107	4	5
III-108	5	5
III-111	5	5
III-117	5	5
III-118	5	5
III-120	4	5
III-130	5	5
III-139	5	5
III-158	5	5
III-173	5	5
III-189	5	5
III-201	5	5
III-202	5	5
III-207	5	5
III-209	5	5
III-212	4	5
III-213	5	5
III-220	5	4
III-221	4	5
III-229	5	5
III-231	5	5
III-232	5	5
III-233	5	5
III-234	5	5
III-236	5	5
III-237	5	5
III-238	5	5
III-239	5	5
III-240	5	5
III-242	4	5
III-243	5	5
III-244	5	5
III-245	5	5
III-246	4	5
III-247	4	5
IV-1	5	5
IV-2	5	5
IV-3	5	5
IV-4	5	5

Tabela 152

Composto No.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
IV- 6	5	5
IV- 7	5	5
IV- 8	5	5
IV- 9	5	5
IV-11	5	5
IV-13	5	5
IV-17	5	5
IV-18	5	5
IV-19	5	5
IV-20	5	5
IV- 21	5	5
IV-23	5	5
IV-24	5	5
IV-30	4	5
IV-33	5	5
IV-34	5	5
IV-39	5	5
IV-40	5	5
IV-41	5	5
IV- 44	5	5
IV-52	5	4
IV-57	5	5
IV-62	5	5
IV-85	5	5
IV-90	5	5
IV-95	5	5
IV-100	5	5
IV-101	5	5
IV-106	5	5
IV-128	5	5
IV-136	5	5
IV-150	5	5
IV-151	5	5
IV-152	5	5
IV-153	5	5
IV-154	5	5
IV-155	5	5
IV-156	5	5
IV-157	5	5
IV-158	5	5
IV-159	5	5
IV-160	5	5
IV-161	5	5
IV-165	5	5
IV-166	5	5
IV-168	5	5
IV-169	5	5
IV-170	5	5

Tabela 153

Composto No.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
IV-173	5	5
IV-177	5	5
IV-17 8	5	5
IV-17 9	5	5
IV-180	4	5
IV-184	5	5
IV-186	5	5
IV-187	5	5
IV-188	5	5
IV-189	5	4
IV-200	5	5
IV-201	5	5
TV-202	5	5
IV-203	5	5
IV-206	5	5
IV-208	5	5
IV-209	5	5
IV-210	5	5
IV-212	5	5
IV-213	5	5
IV-214	5	5
IV-215	5	5
IV-216	5	5
IV-217	5	5
IV-218	5	5
IV- 219	5	5
IV-220	5	5
IV-221	5	5
IV-222	5	5
IV-223	5	5
IV-224	5	5
IV- 225	5	5
IV-226	5	5
IV-227	5	5
IV-22 8	5	5
IV-229	5	5
IV-230	5	5
IV-231	5	5
IV-232	5	5
IV-23 3	5	5
IV-234	5	5
IV-235	5	5
IV-236	5	5
IV-237	5	5
IV-238	5	5
IV-239	4	5
IV-240	5	5
IV-241	4	5
IV-242	5	5
IV-243	5	5

Tabela 154

Composto No.	<i>Abutilon theophrasti medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
IV-244	5	5
IV-245	5	5
IV- 247	5	5
IV- 248	5	5
IV-249	4	5
IV-250	4	5
IV-251	4	5
IV-252	5	5
IV-253	5	5
IV-254	5	5
IV-255	5	5
IV-256	5	5
IV-257	5	5
IV-258	5	5
IV-259	5	5
IV-260	5	5
IV-262	5	5
IV-266	5	5
IV-267	5	5
IV-268	5	5
IV-269	5	5
IV-271	4	5
Composto Comparativo A	1	0
Composto Comparativo B	2	2
Composto Comparativo C	0	3
Composto Comparativo D	0	3

Adicionalmente, composto comparativo A, composto comparativo B, composto comparativo C e composto comparativo D nas tabelas são Composto Nos. 70, 34, 32 e 31 descritos em EP-283261, respectivamente. Adicionalmente, composto comparativo A e composto comparativo B nas tabelas são Composto No. 70 e Composto No. 34 descrito in EP-283261, respectivamente.

<Exemplo de teste 3> Teste dos efeitos herbicidas no tratamento das folhas de campo de planície

Um pote plástico de 80 cm² foi carregado com solo de campo de planície. Sementes de *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. var. *crus-galli*, *Abutilon theophrasti medicus* e *Amaranthus viridis* L. foram semeadas e as plantas cresceram por duas semanas em uma estufa. Uma formulação de pó umectável preparada de acordo com o exemplo de preparação 1 foi diluída com água, e foi aspergida com um aspersor pequeno para realizar a aplicação nas folhas em toda a planta do lado superior, em uma quantidade equivalente a 1.000 litros por hectare, de maneira tal que 1.000 g do ingrediente ativo por hectare fosse aplicado. Daí em diante, as plantas cresceram em uma estufa e

no 14º dia depois do tratamento os efeitos herbicidas foram investigados de acordo com os critérios descritos na tabela 138 mostrada a anteriormente. Os resultados são apresentados na seguinte tabela 155 a tabela 162.

Tabela 155

Composto No.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti</i> <i>medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
I-2	4	5	5
I-5	4	5	5
I-7	4	5	5
I-12	4	5	5
I-13	5	5	5
I-14	4	5	5
I-15	5	5	5
I-21	5	5	5
I-22	4	5	5
I-30	4	5	5
I-35	4	5	5
I-40	5	5	5
I-49	4	5	5
I-50	4	5	5
I-58	5	5	5
I-59	5	5	5
I-62	5	5	5
I-65	4	5	5
I-67	4	5	5
I-68	4	5	5
I-70	5	5	5
I-71	5	5	5
I-72	5	5	5
I-82	4	5	5
I-88	5	5	5
I-90	5	5	5
I-91	5	5	5
I-92	5	5	5
I-93	5	5	5
I-94	5	5	5
I-99	5	5	5
I-100	5	4	5
I-102	5	5	5
I-103	5	5	5
I-107	4	5	5
I-111	5	5	5
I-112	4	5	5
I-131	5	5	5
I-136	4	5	5
I-137	4	5	5
I-139	4	5	5
I-144	5	5	5
I-145	5	5	5
I-148	5	5	5
I-149	5	5	5
I-156	5	5	5
I-158	5	5	5
I-159	4	5	5
I-160	5	5	5
I-163	4	5	5

Tabela 156

Composto No.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti</i> <i>medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
I-171	5	5	5
I-173	5	5	5
I-176	5	5	5
I-177	5	5	5
I-179	5	5	5
I-180	4	5	5
I-182	5	5	5
I-185	5	5	5
I-189	4	5	5
I-195	5	5	5
I-197	5	5	5
I-199	5	5	5
I-201	5	4	5
I-202	4	5	5
I-207	5	5	5
I-211	5	5	5
I-212	5	4	5
I-213	5	5	5
I-220	5	5	5
I-221	4	5	5
I-225	4	5	5
I-227	4	5	5
I-229	4	5	5
I-230	5	5	5
I-243	5	5	5
I-247	4	5	5
I-263	5	5	5
I-266	5	5	5
I-267	5	5	5
I-268	5	5	5
I-269	5	5	5
I-270	5	5	5
I-271	5	5	5
I-272	5	5	5
I-275	5	4	5
I-277	5	5	5
I-281	5	5	5
I-283	4	5	5
I-364	5	5	5
I-371	5	5	5
I-372	4	5	5
I-373	5	5	5
I-380	4	5	5
II-1	5	5	5
II-4	4	5	5
II-5	5	5	5
II-6	5	5	5
II-7	5	5	5
II-8	5	5	5
II-9	5	5	5
II-11	5	5	5
II-13	5	5	5

Tabela 157

Composto No.	Echinochloa crus-galli (L.) P. Beauv. var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
II-14	5	4	5
II-15	5	5	5
II-20	5	5	5
II-21	5	5	5
II-23	5	5	5
II-24	5	4	5
II-33	5	5	5
II-39	5	5	5
II-44	5	5	5
II-51	4	5	5
II-52	5	5	5
II-57	5	5	5
II-62	4	5	5
II-63	5	4	5
II-64	5	5	5
II-68	5	5	5
II-69	5	5	5
II-71	4	5	5
II-74	3	4	4
II-75	5	4	5
II-84	4	4	5
II-90	5	5	5
II-95	5	5	5
II-101	5	5	5
II-116	4	4	5
II-121	4	4	4
II-122	5	4	5
II-124	5	4	5
II-125	5	5	5
II-129	5	5	5
II-130	5	5	5
II-131	5	5	5
II-136	5	5	5
II-137	5	5	5
II-149	5	5	5
II-167	5	5	5
II-168	4	5	5
II-173	4	5	5
II-178	5	5	5
II-185	4	5	5
II-188	4	5	5
II-189	5	5	5
II-190	4	5	5
II-196	5	5	5
II-197	5	4	5
II-208	4	5	5
II-210	4	5	5
II-211	5	5	5

Tabela 158

Composto No.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti</i> <i>medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
II-212	5	5	5
II-213	4	5	5
II-214	5	5	5
II-215	5	5	5
II-217	4	5	5
II-218	4	5	5
II-219	5	5	5
II-220	5	5	5
II-221	5	5	5
II-222	5	5	5
II-223	5	5	5
II-224	5	5	5
II-225	5	5	5
II-226	5	5	5
II-227	5	4	5
II-228	5	5	5
II-231	5	5	5
II-233	5	5	5
II-234	4	5	5
II-237	5	5	5
II-238	5	5	5
II-239	4	5	5
II-241	5	5	5
II-242	5	4	5
II-243	5	5	5
II-244	5	5	5
II-249	5	5	5
II-252	5	5	5
II-254	5	4	5
II-255	5	4	5
II-256	5	4	5
II-257	5	4	5
II-260	5	5	5
II-261	5	5	5
II-263	5	4	5
II-303	5	5	5
II-304	4	5	5
II-305	5	5	5
III-2	5	5	5
III-5	5	5	5
III- 7	4	5	5
III-12	4	5	5
III-13	4	5	5
III-15	5	5	5
III-30	4	5	5
III-35	4	5	5
III-40	4	5	5
III-45	5	5	5
III-59	5	5	5
III-88	5	5	5

Tabela 159

Composto No.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti</i> <i>medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
III-90	5	5	5
III-96	5	5	5
III-99	4	5	5
III-107	4	5	5
III-108	5	5	5
III-111	5	5	5
III-117	5	5	5
III-118	5	5	5
III-120	5	5	5
III-130	5	5	5
III-139	4	5	5
III-158	5	5	5
III-173	5	5	5
III-189	5	5	5
III-201	5	5	5
III-202	5	5	5
III-207	5	5	5
III-209	5	5	5
III-212	5	5	5
III-213	4	5	5
III-221	4	5	5
III-229	5	5	5
III-230	5	5	5
III-231	5	5	5
III-232	5	5	5
III-234	5	5	5
III-235	5	5	5
III-236	4	5	5
III-237	5	5	5
III-238	5	5	5
III-239	4	5	5
III-240	4	5	5
III-241	4	5	5
III-242	5	5	5
III-243	5	5	5
III-246	5	5	5
III-247	5	5	5
IV-1	5	5	5
IV-2	5	5	5
IV-3	5	5	5
IV-4	5	5	5
IV-6	4	5	5
IV-7	5	5	5
IV-8	5	5	5
IV-9	5	5	5
IV-11	5	5	5
IV-13	5	5	5

Tabela 160

Composto No.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti</i> <i>medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
IV-17	5	5	5
IV-18	5	5	5
IV-19	5	5	5
IV-20	5	5	5
IV-21	5	5	5
IV-23	5	4	5
IV-24	5	4	5
IV-30	5	4	5
IV-33	5	5	5
IV-34	5	5	5
IV-39	5	5	5
IV-40	5	5	5
IV-41	5	5	5
IV-44	5	5	5
IV-52	5	5	5
IV-57	4	5	5
IV-62	5	5	5
IV-85	5	5	5
IV-90	5	5	5
IV-95	5	5	5
IV-100	5	5	5
IV-101	5	5	5
IV-106	5	5	5
IV-128	5	5	5
IV-136	5	5	5
IV-150	5	5	5
IV-151	5	5	5
IV-152	5	5	5
IV-153	4	5	5
IV-154	5	5	5
IV-155	5	5	5
IV-156	5	5	5
IV-157	4	5	5
IV-158	5	5	5
IV-160	5	5	5
IV-161	5	5	5
IV-165	5	5	5
IV-166	5	5	5
IV-168	5	5	5
IV-169	5	5	5
IV-173	5	5	5
IV-174	4	5	5
IV-177	4	5	5
IV-178	5	5	5
IV-179	5	4	5
IV-180	5	5	5
IV-184	5	5	5

Tabela 161

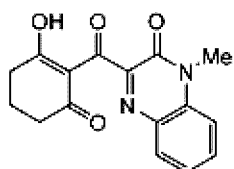
Composto No.	Echinochloa crus-galli (L.) P. Beauv. var. crus-galli	Abutilon theophrasti medicus	Amaranthus viridis L.
IV-185	5	4	5
IV-186	5	5	5
IV-187	5	5	5
IV-188	5	5	5
IV-189	5	5	5
IV-200	5	5	5
IV-201	5	5	5
IV-202	5	5	5
IV-203	5	5	5
IV-206	5	5	5
IV-208	5	4	5
IV-209	5	5	5
IV-210	5	5	5
IV-212	5	5	5
IV-213	5	5	5
IV-214	5	5	5
IV-215	5	5	5
IV-216	5	5	5
IV-217	5	5	5
IV-218	5	5	5
IV-219	5	5	5
IV-220	5	5	5
IV-221	5	5	5
IV-222	5	5	5
IV-223	5	5	5
IV-224	5	5	5
IV-225	5	5	5
IV-226	5	5	5
IV-227	5	5	5
IV-228	5	5	5
IV-229	5	5	5
IV-230	5	5	5
IV-231	5	5	5
IV-232	5	5	5
IV-233	5	5	5
IV-234	5	5	5
IV-235	5	5	5
IV-236	5	5	5
IV-237	5	5	5
IV-238	5	5	5
IV-239	5	5	5
IV-240	5	5	5
IV-241	5	4	5
IV-242	5	5	5
IV-243	5	5	5
IV-244	5	5	5
IV-245	5	5	5
IV-247	5	5	5
IV-248	5	5	5

Tabela 162

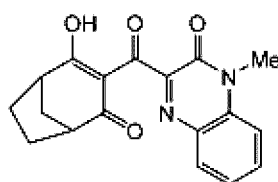
Composto No.	<i>Echinochloa crus-galli</i> (L.) P. Beauv. var. <i>crus-galli</i>	<i>Abutilon theophrasti</i> <i>medicus</i>	<i>Amaranthus viridis</i> L.
IV-251	5	4	5
IV-252	5	5	5
IV-253	5	5	5
IV-254	5	5	5
IV-255	5	5	5
IV-256	5	5	5
IV-257	4	5	5
IV-258	5	5	5
IV-259	5	5	5
IV-260	4	5	5
IV-262	4	5	5
IV-266	5	5	5
IV-267	4	5	5
IV-268	5	5	5
IV-269	5	5	5
IV-271	5	5	5
Composto Comparativo A	0	2	1
Composto Comparativo B	0	5	1
Composto Comparativo C	0	4	0
Composto Comparativo D	0	4	1

REIVINDICAÇÕES

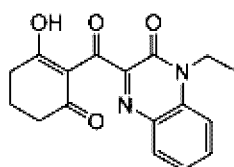
1. Derivado de oxopirazina ou um sal agroquimicamente aceitável do mesmo, caracterizado pelo fato de ser representado pelos seguintes compostos:



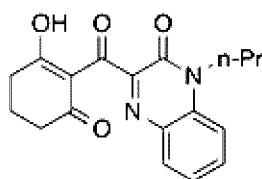
I-2,



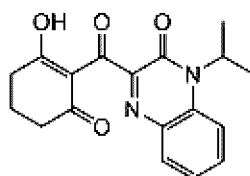
I-5,



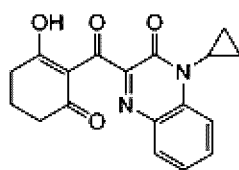
I-7,



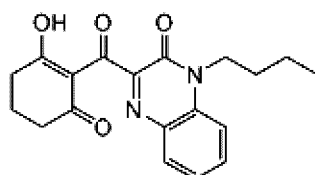
I-12,



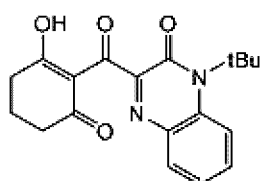
I-13,



I-14,



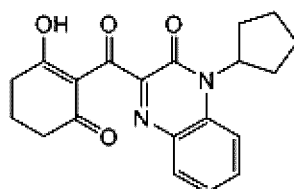
I-15,



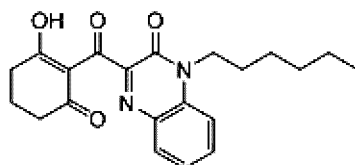
I-18,

5

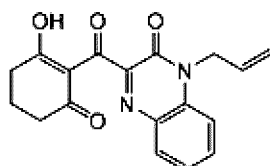
10



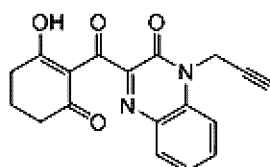
I-21,



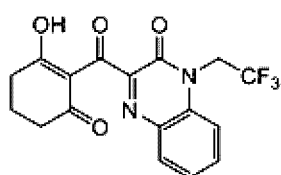
I-22,



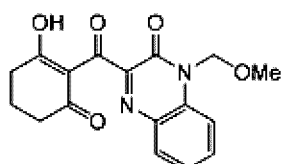
I-30,



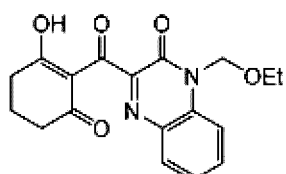
I-35,



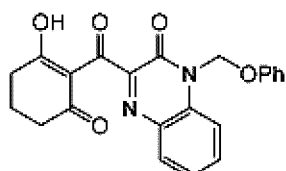
I-40,



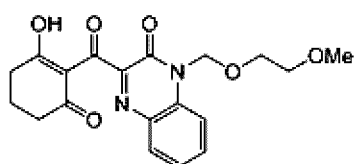
I-49,



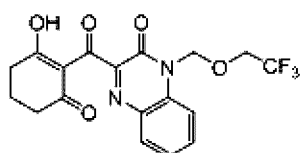
I-50,



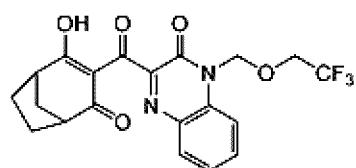
I-57,



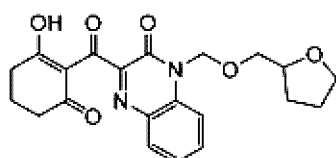
I-58,



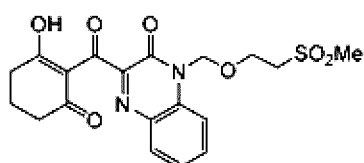
I-59,



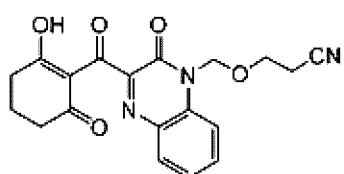
I-62,



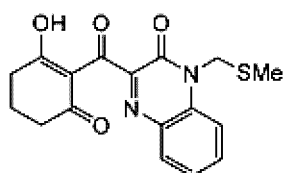
I-65,



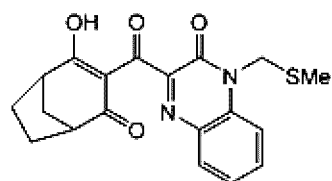
I-67,



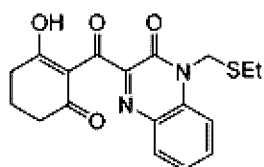
I-68,



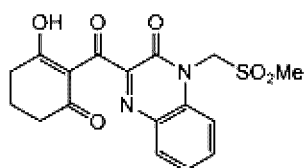
I-70,



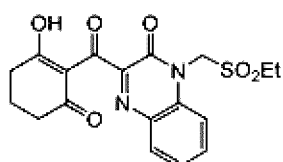
I-71,



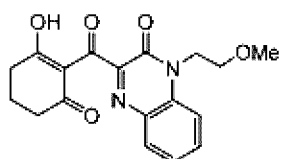
I-72,



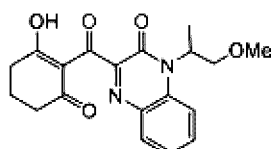
I-80,



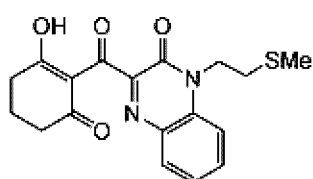
I-82,



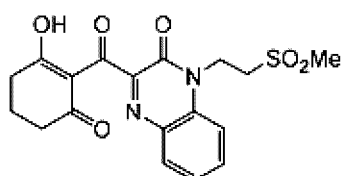
I-88,



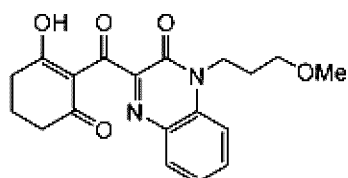
I-90,



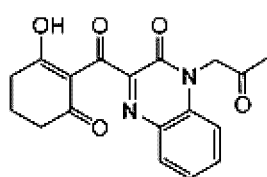
I-91,



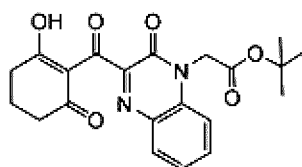
I-92,



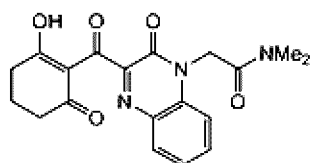
I-93,



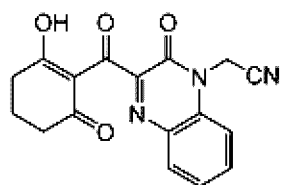
I-94,



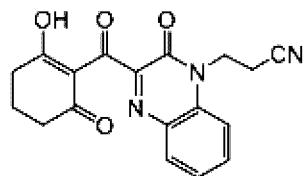
I-99,



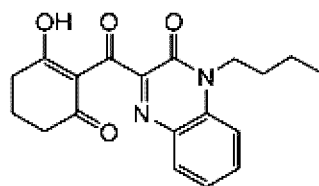
I-100,



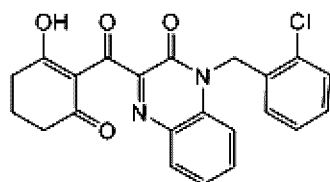
I-102,



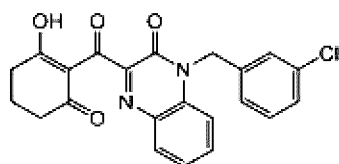
I-103,



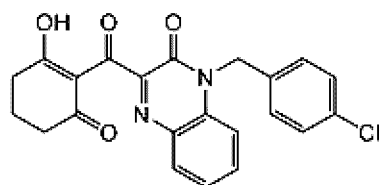
I-107,



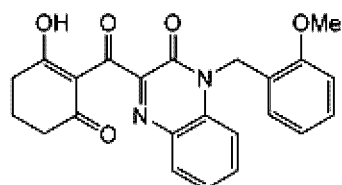
I-111,



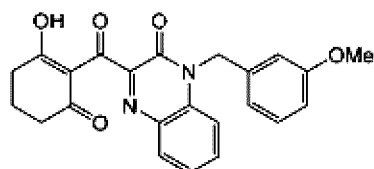
I-112,



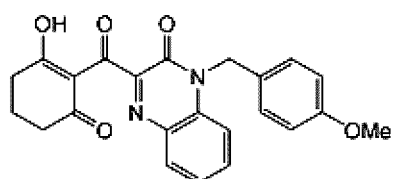
I-113,



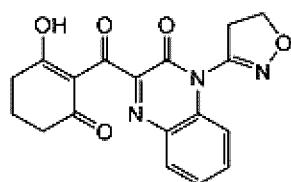
I-120,



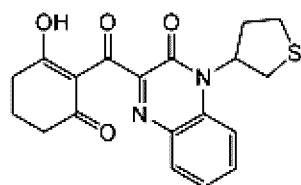
I-125,



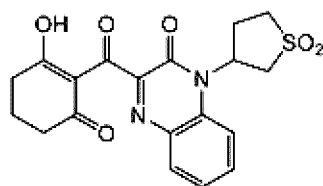
I-126,



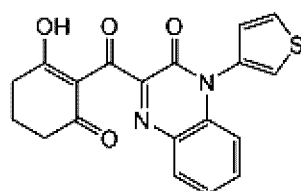
I-131,



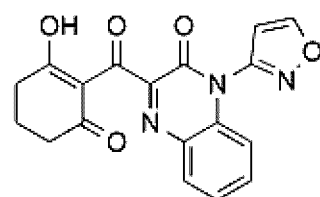
I-136,



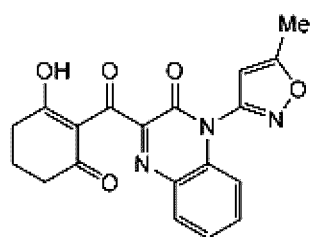
I-137,



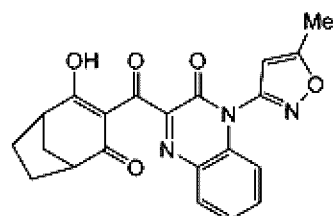
I-139,



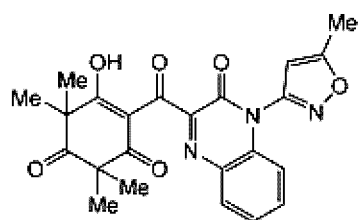
I-144,



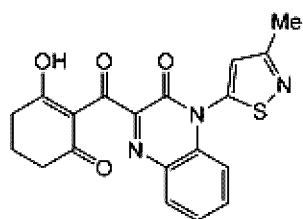
I-145,



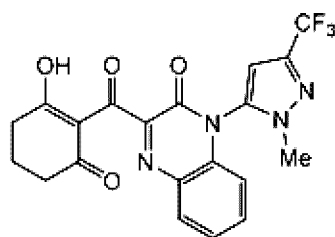
I-148,



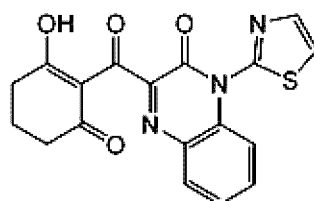
I-149,



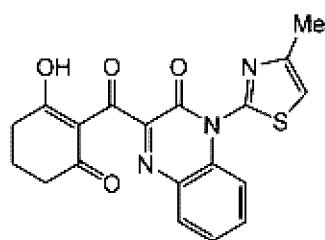
I-156,



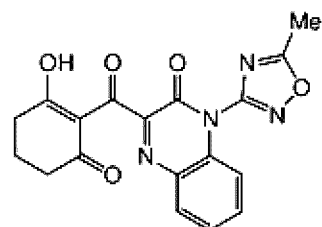
I-158,



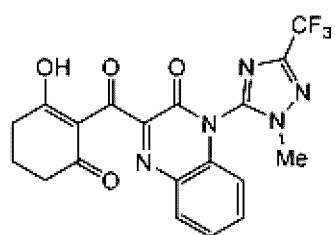
I-159,



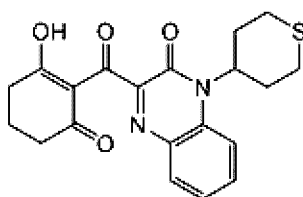
I-160,



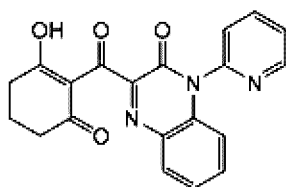
I-163,



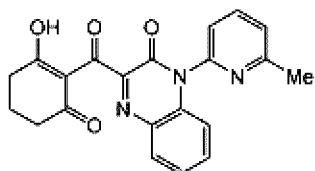
I-165,



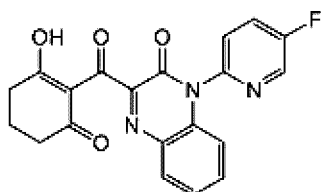
I-166,



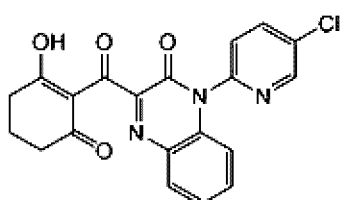
I-171



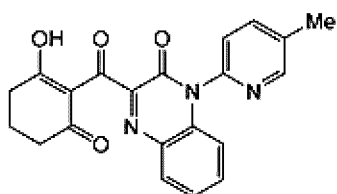
I-173



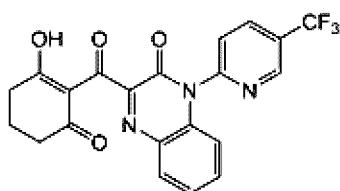
I-176



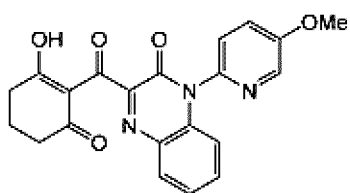
I-177



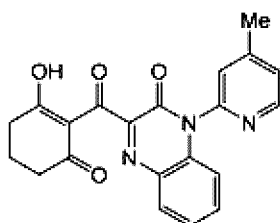
I-178



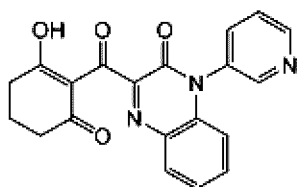
I-179



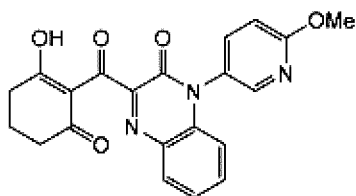
I-180



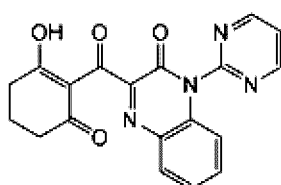
I-182



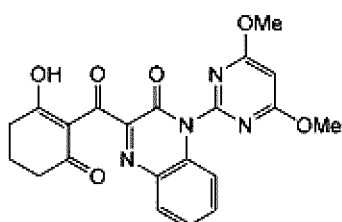
I-185



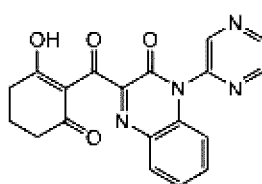
I-189



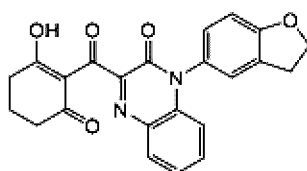
I-195



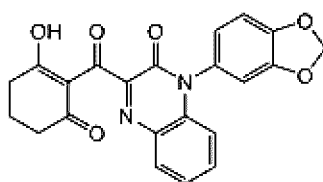
I-197



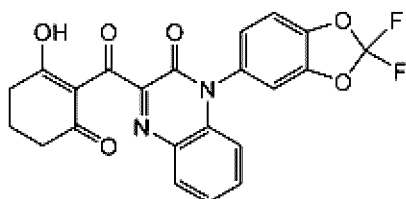
I-199



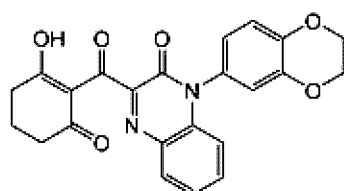
I-201



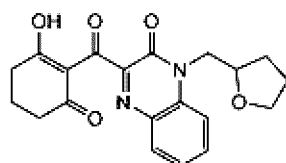
I-202



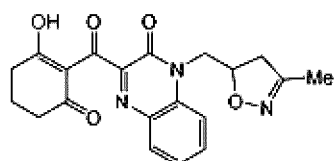
I-207



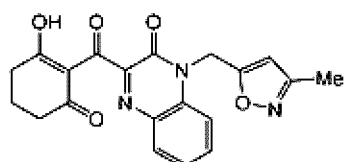
I-209



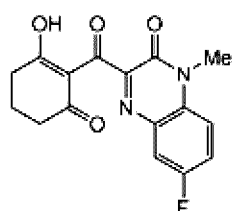
I-211



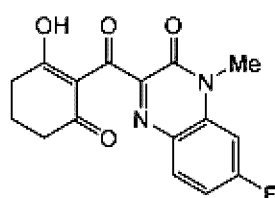
I-212



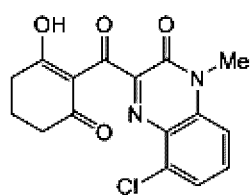
I-213



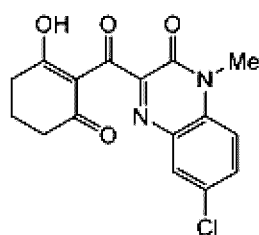
I-220



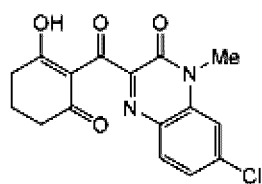
I-221



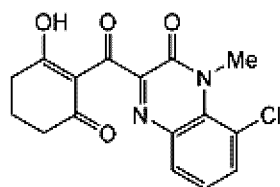
I-223



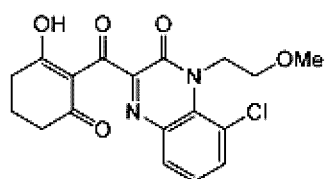
I-225



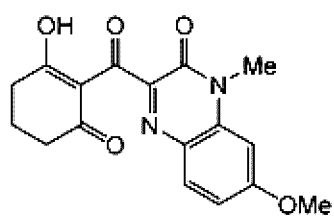
I-227



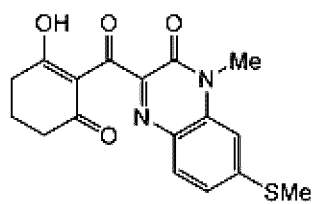
I-229



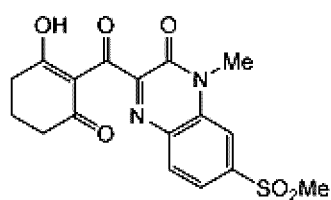
I-230



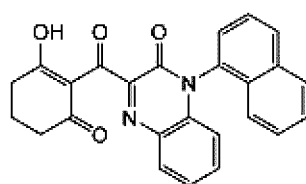
I-238



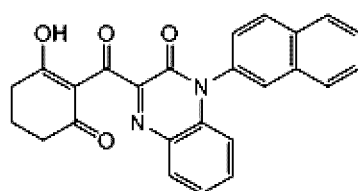
I-243



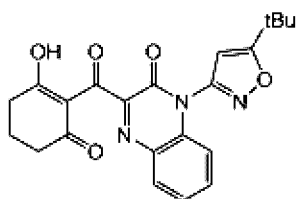
I-247



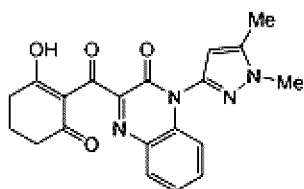
I-263



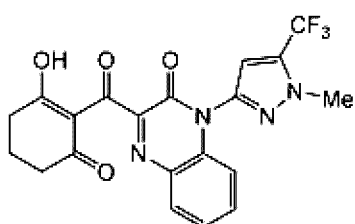
I-264



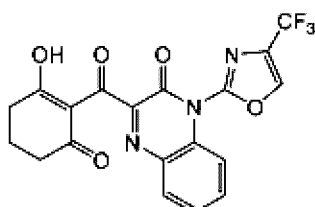
I-265



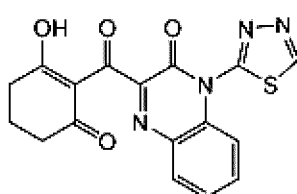
I-266



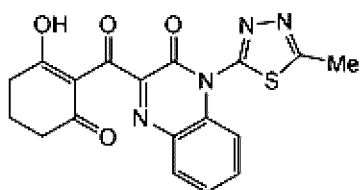
I-267



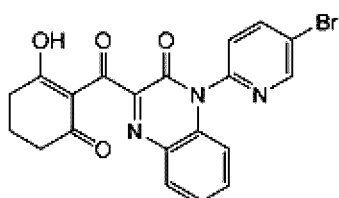
I-268



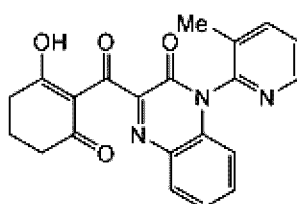
I-269



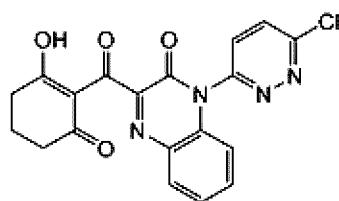
I-270



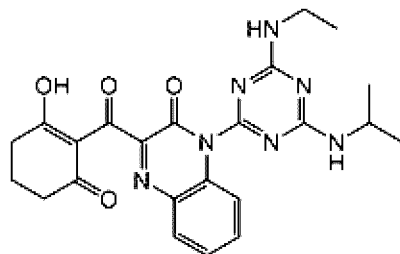
I-271



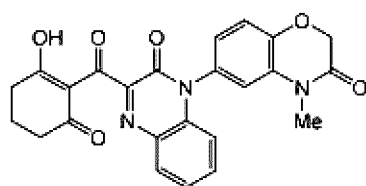
I-272



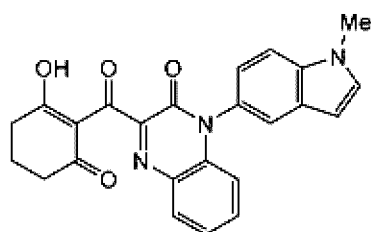
I-273



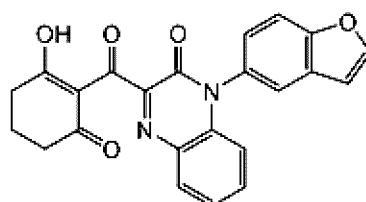
I-274



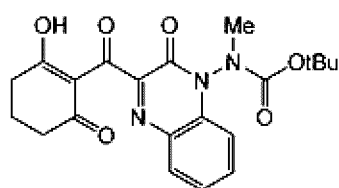
I-275



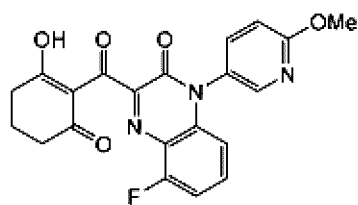
I-276



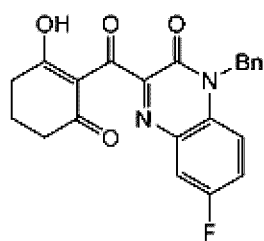
I-277



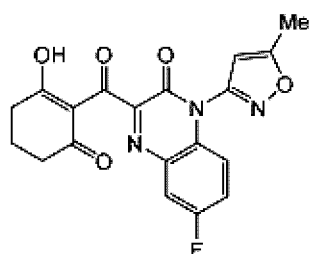
I-278



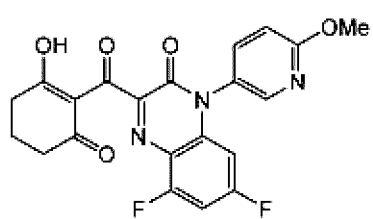
I-279



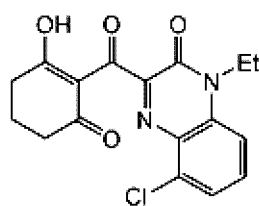
I-280



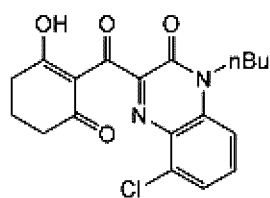
I-281



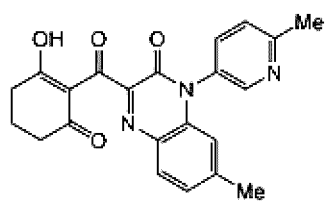
I-283



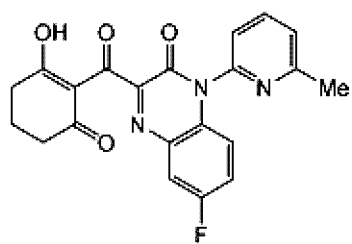
I-363



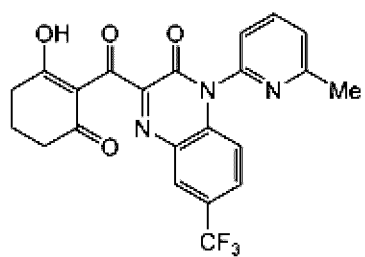
I-364



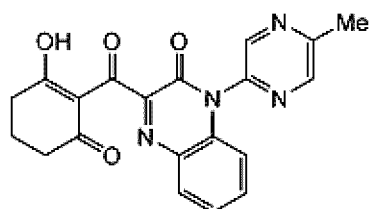
I-368



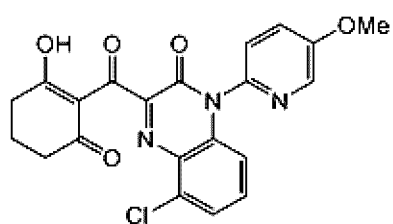
I-371



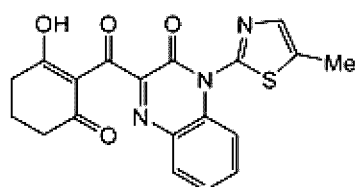
I-372



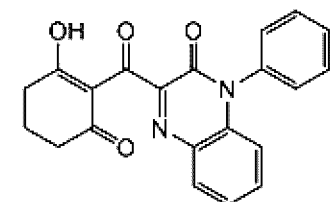
I-373



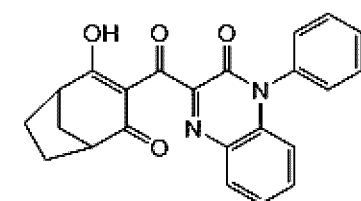
I-379



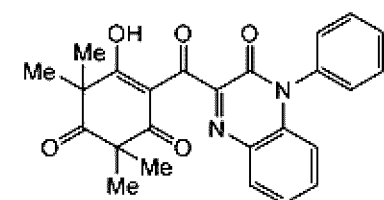
I-380



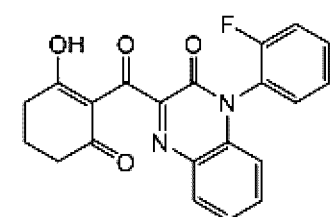
II-1



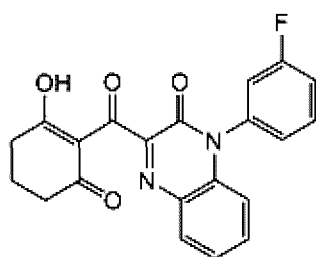
II-4



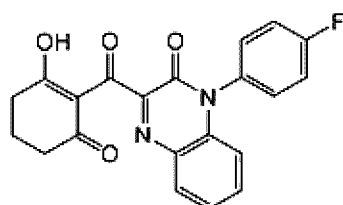
II-5



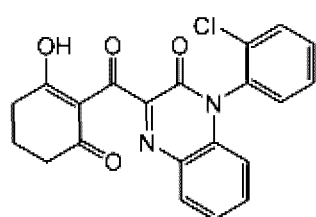
II-6



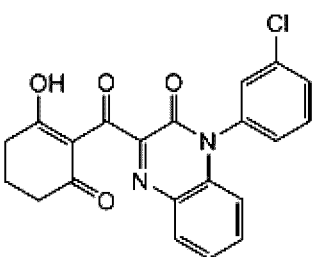
II-7



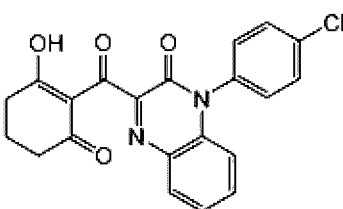
II-8



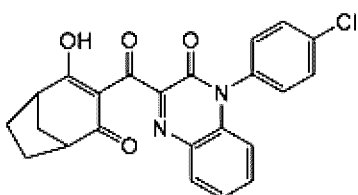
II-9



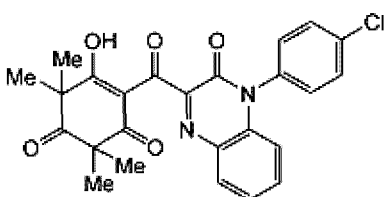
II-11



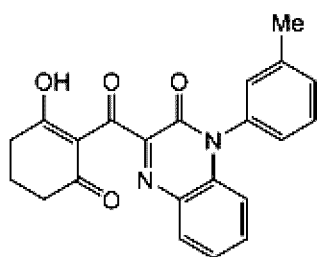
II-13



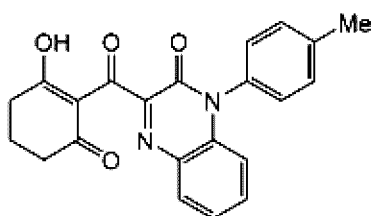
II-14



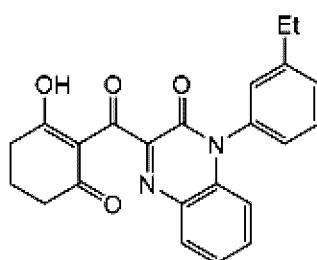
II-15



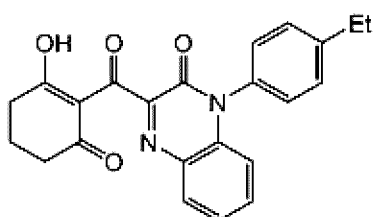
II-20



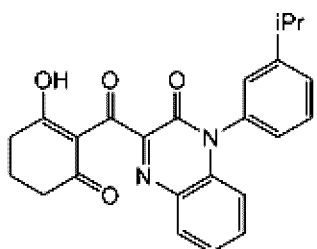
II-21



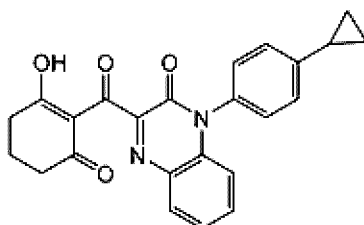
II-23



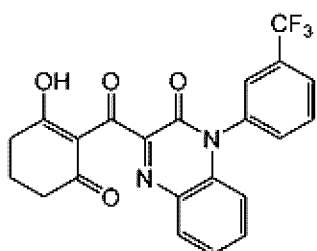
II-24



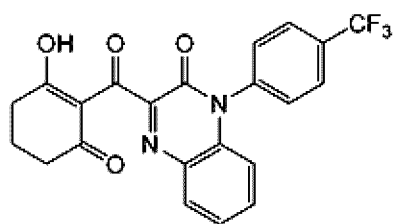
II-29



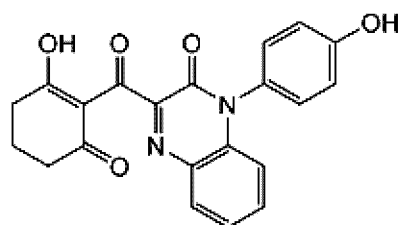
II-33



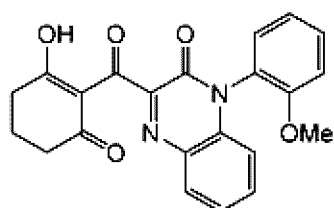
II-39



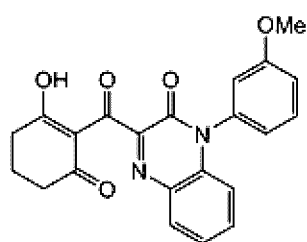
II-44



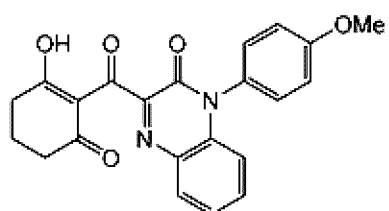
II-51



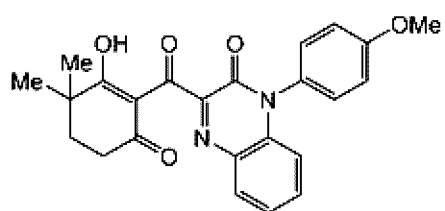
II-52



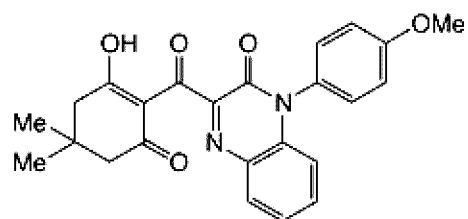
II-57



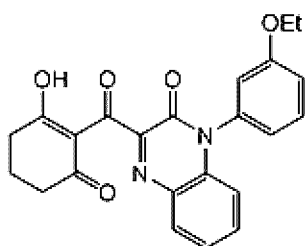
II-62



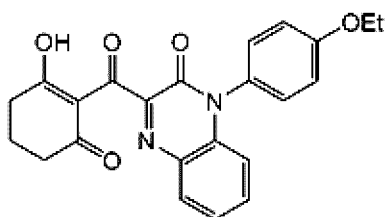
II-63



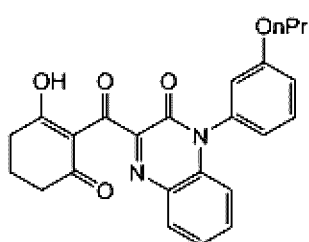
II-64



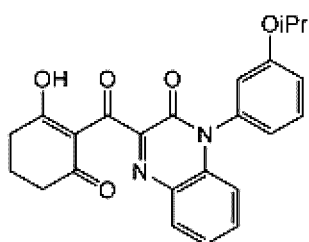
II-68



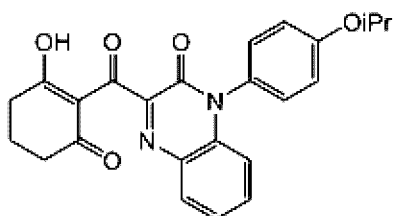
II-69



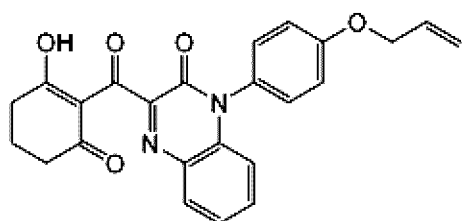
II-71



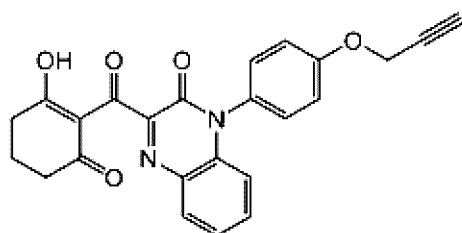
II-74



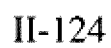
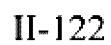
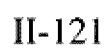
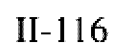
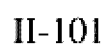
II-75

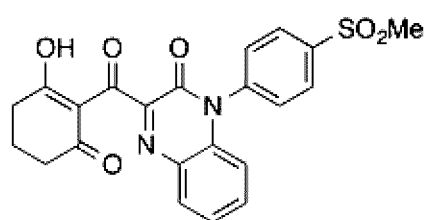


II-81

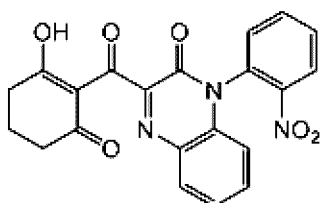


II-84

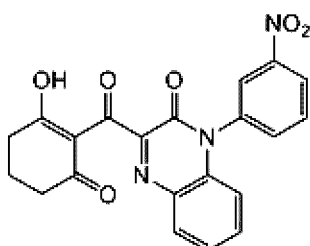




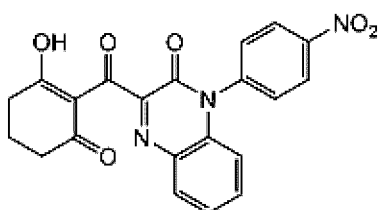
II-125



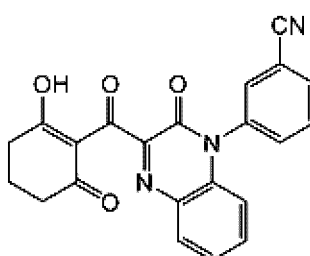
II-129



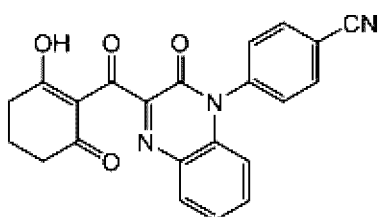
II-130



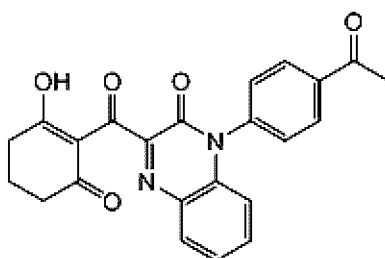
II-131



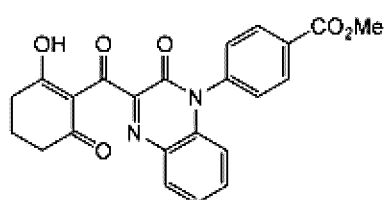
II-136



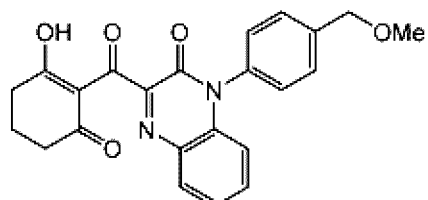
II-137



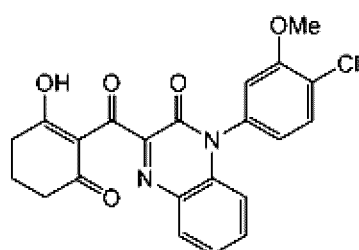
II-140



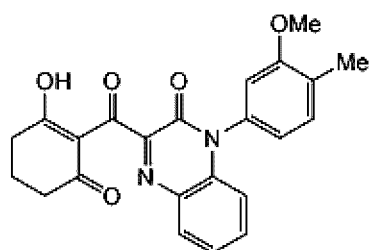
II-146



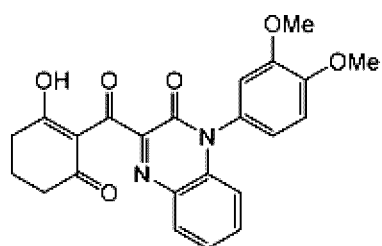
II-149



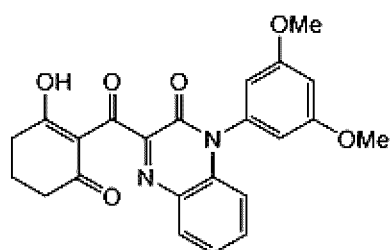
II-167



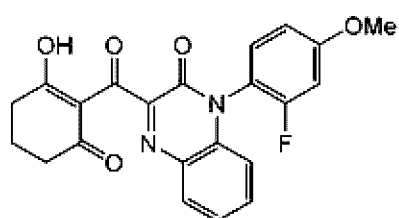
II-168



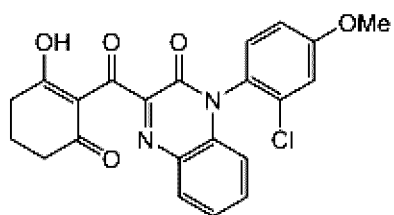
II-169



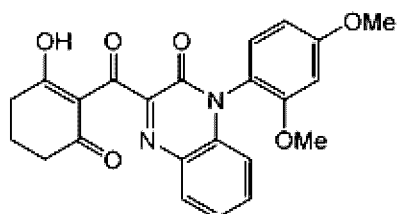
II-173



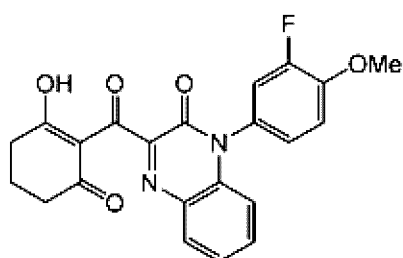
II-174



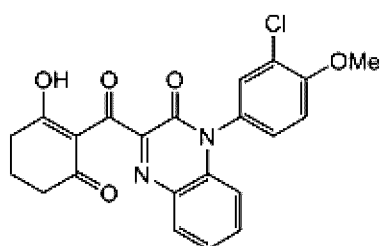
II-175



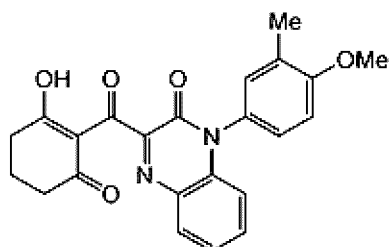
II-177



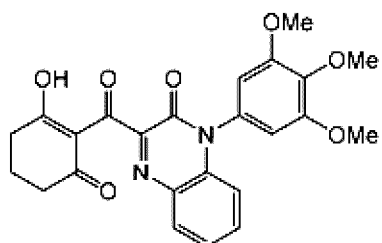
II-178



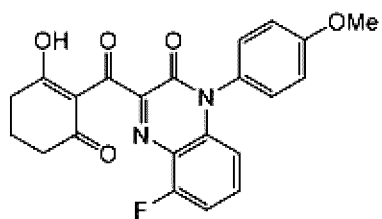
II-179



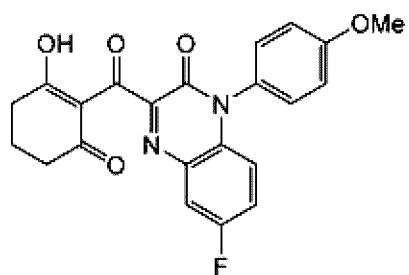
II-180



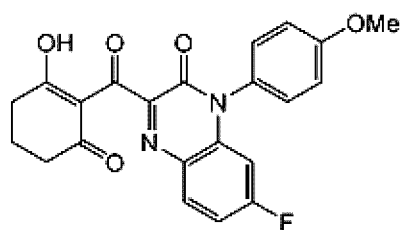
II-185



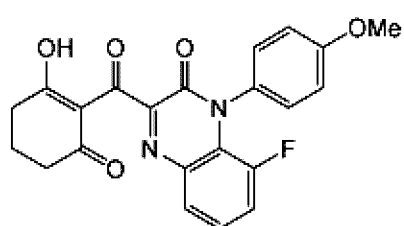
II-186



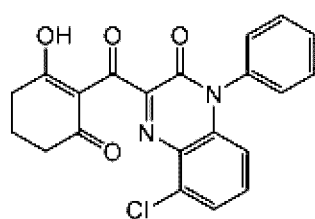
II-187



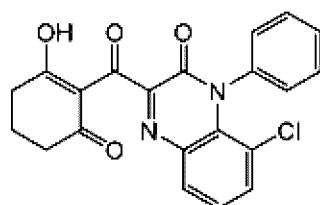
II-188



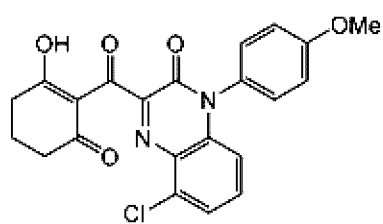
II-189



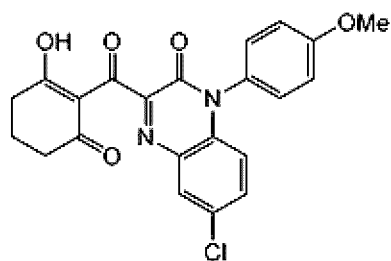
II-190



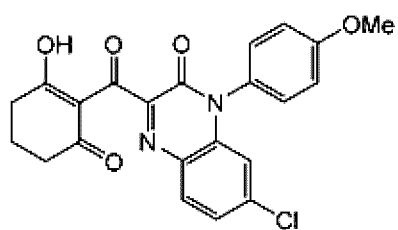
II-193



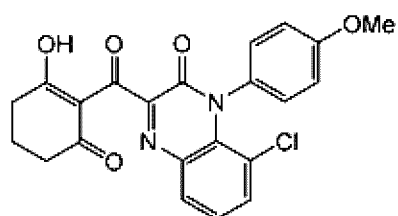
II-194



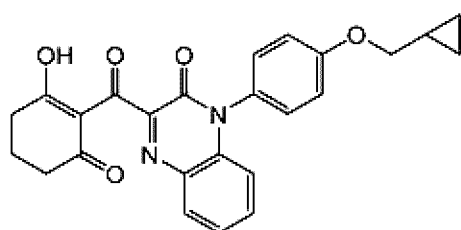
II-195



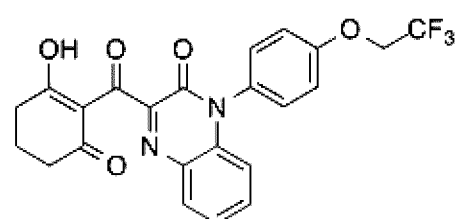
II-196



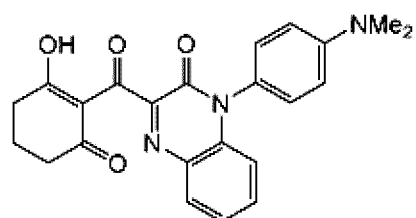
II-197



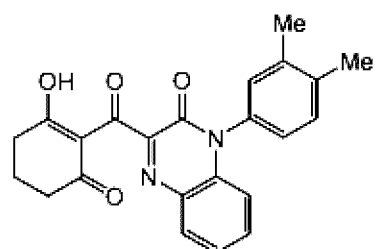
II-208



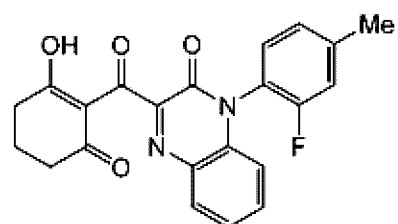
II-209



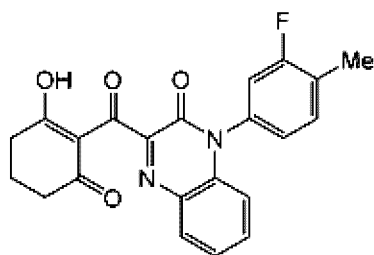
II-210



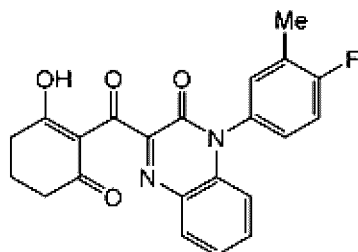
II-211



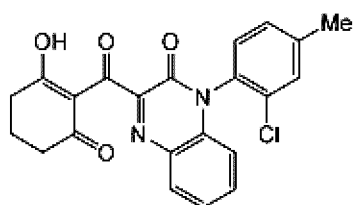
II-212



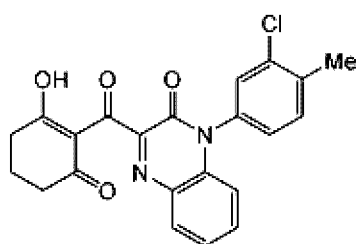
II-213



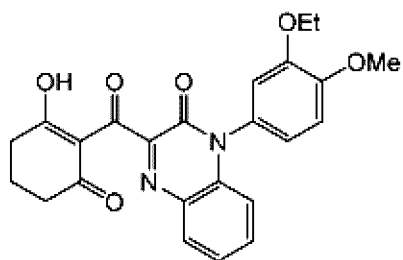
II-214



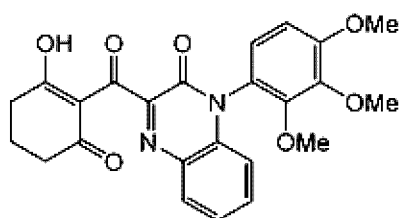
II-215



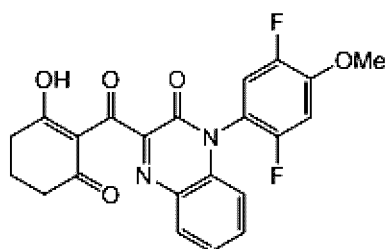
II-216



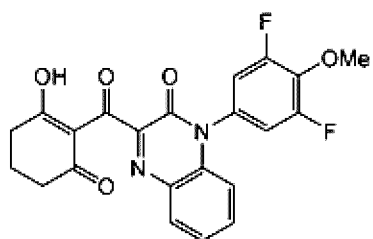
II-217



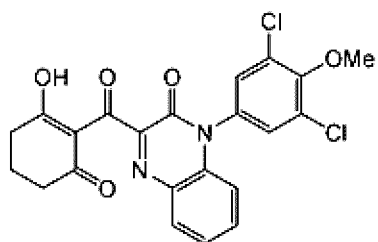
II-218



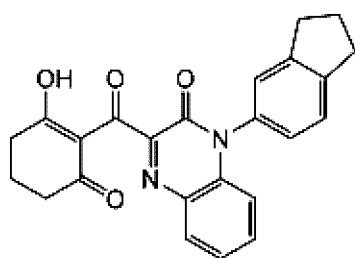
II-219



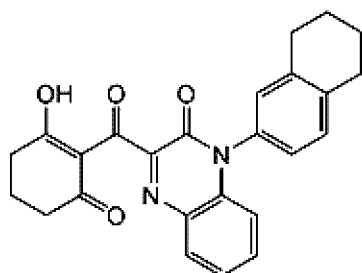
II-220



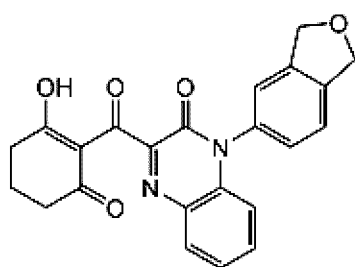
II-221



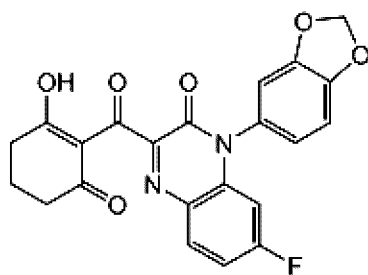
II-222



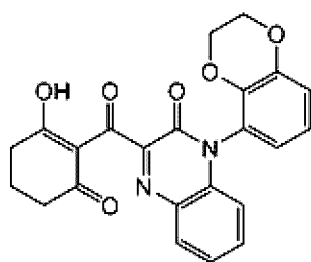
II-223



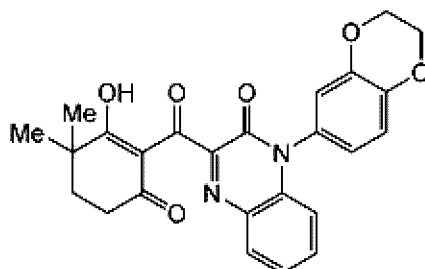
II-224



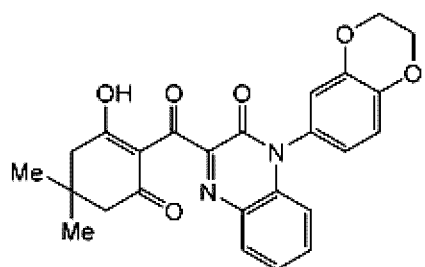
II-225



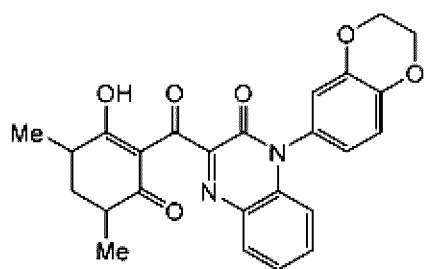
II-226



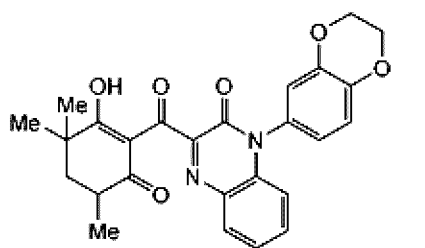
II-227



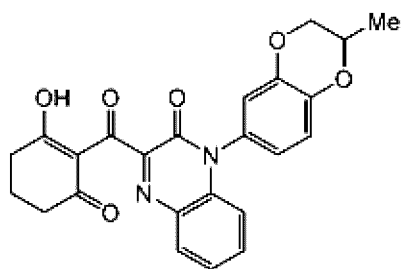
II-228



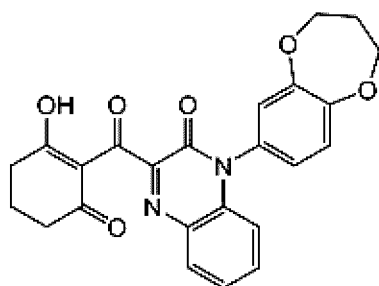
II-229



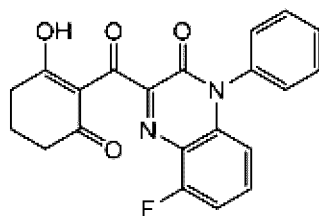
II-230



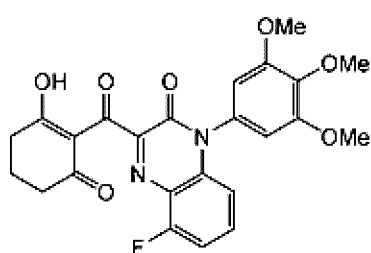
II-231



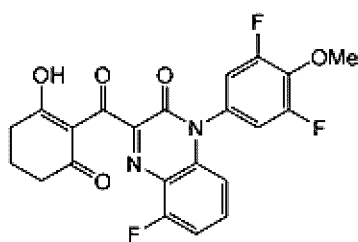
II-232



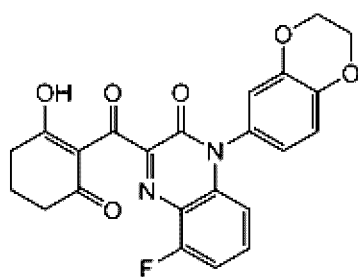
II-233



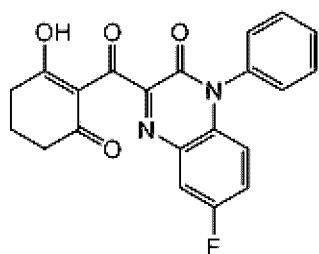
II-234



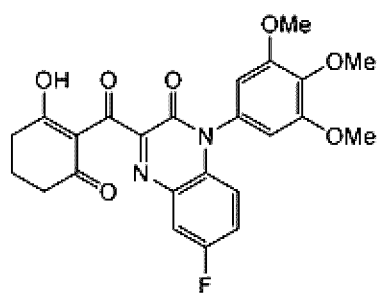
II-235



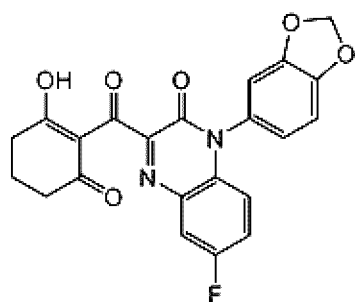
II-236



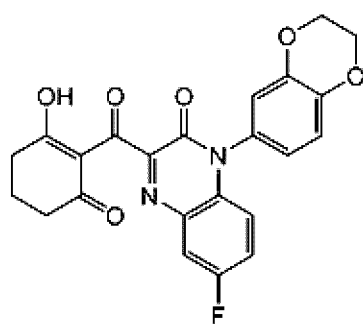
II-237



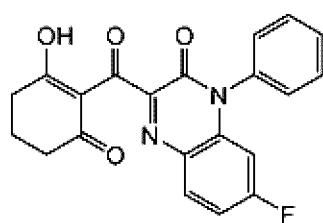
II-238



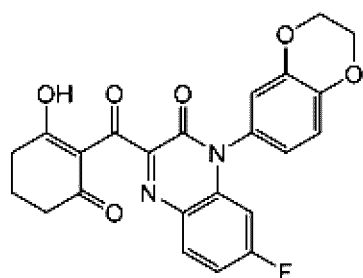
II-239



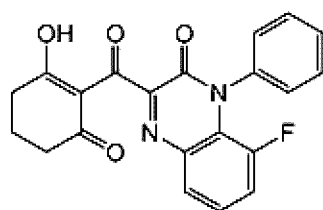
II-240



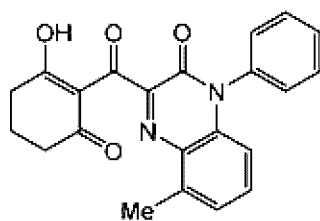
II-241



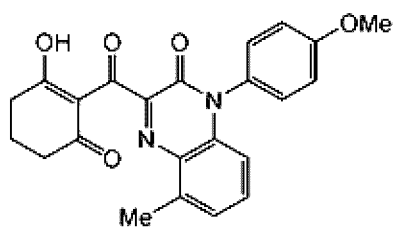
II-242



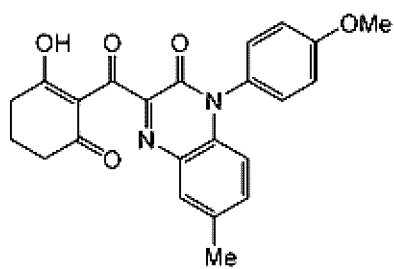
II-243



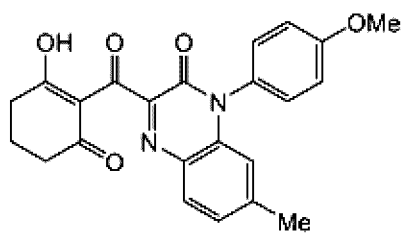
II-244



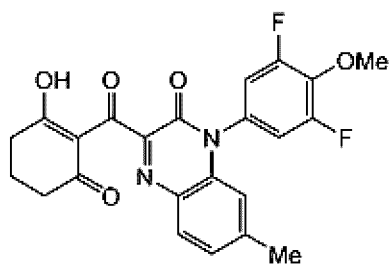
II-245



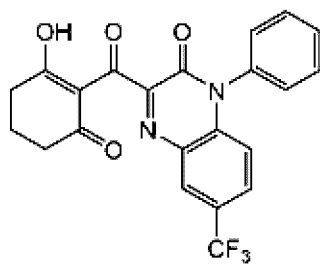
II-246



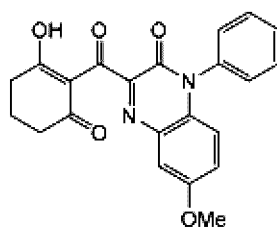
II-247



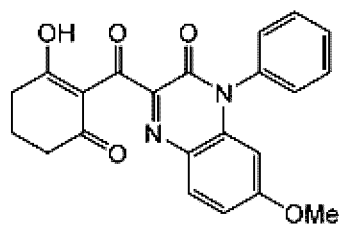
II-248



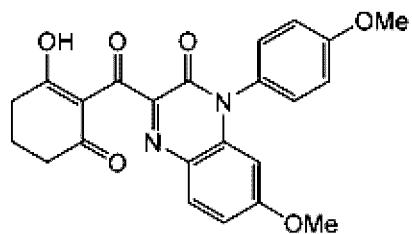
II-249



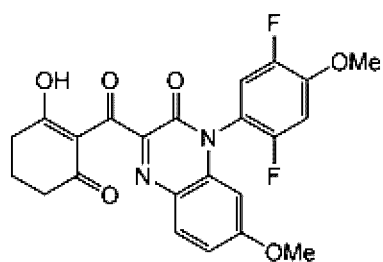
II-250



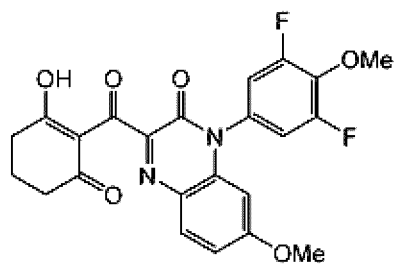
II-252



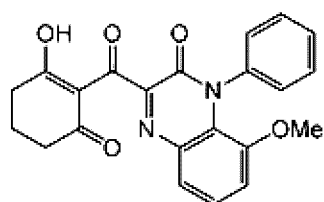
II-253



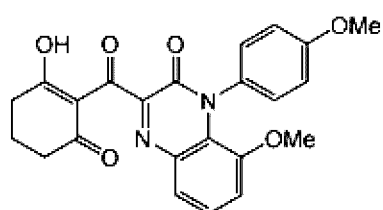
II-254



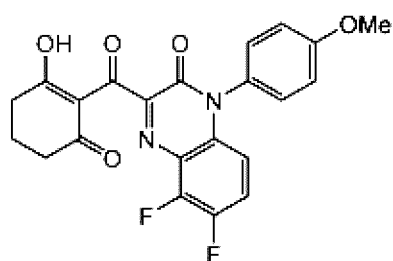
II-255



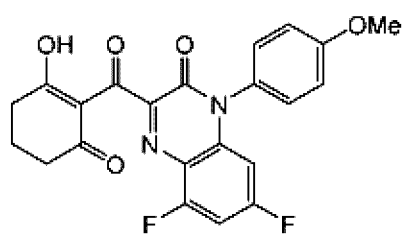
II-256



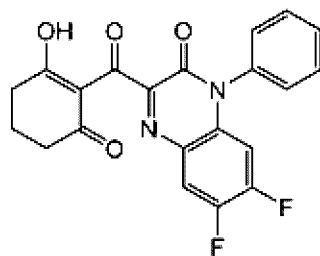
II-257



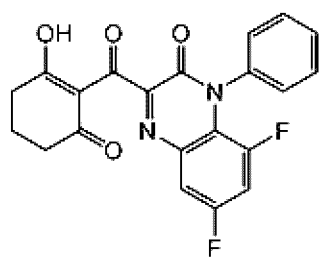
II-258



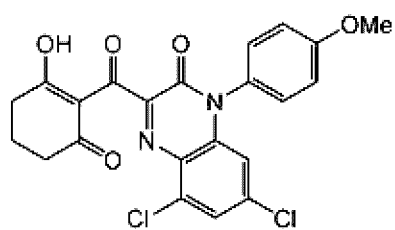
II-259



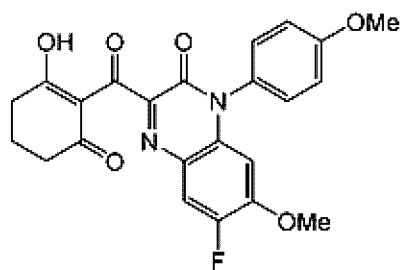
II-260



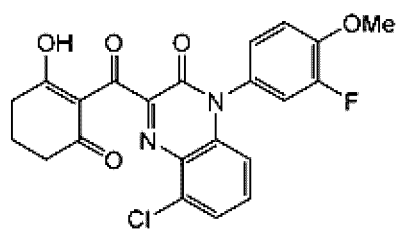
II-261



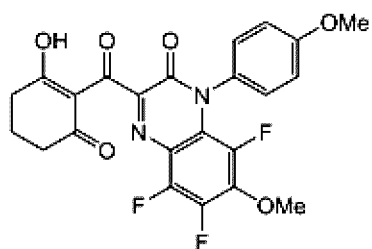
II-262



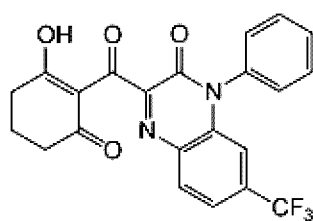
II-263



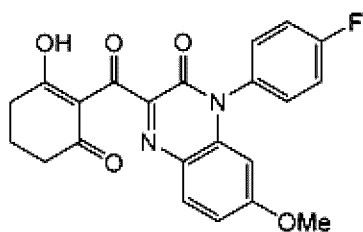
II-301



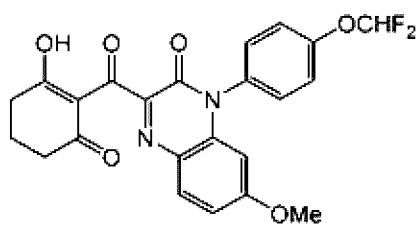
II-302



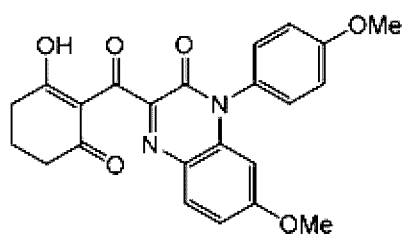
II-303



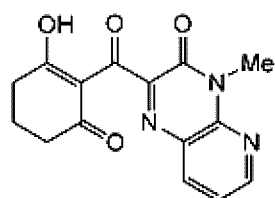
II-304



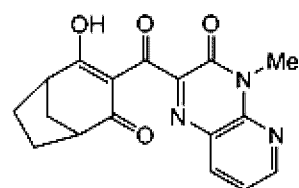
II-305



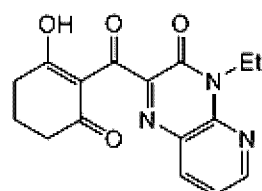
II-306



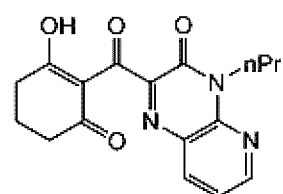
III-2



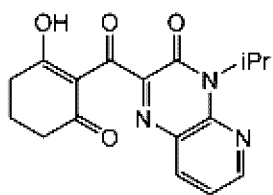
III-5



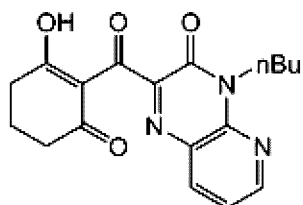
III-7



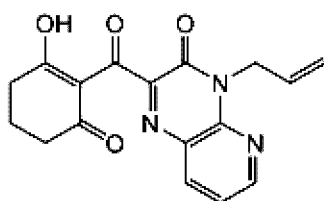
III-12



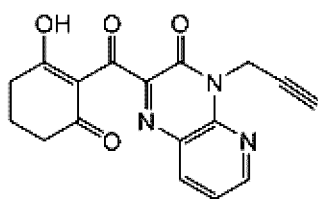
III-13



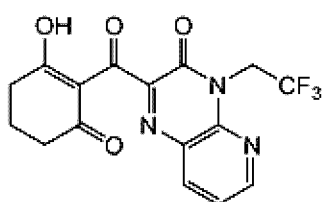
III-15



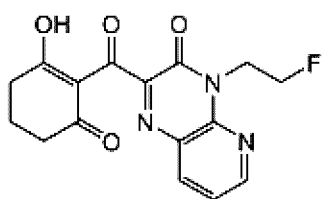
III-30



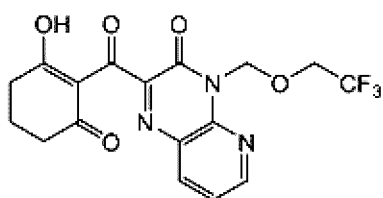
III-35



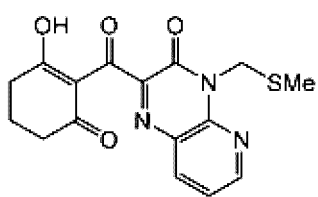
III-40



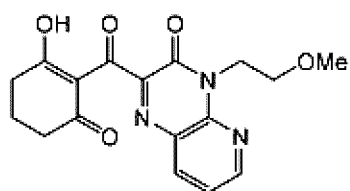
III-45



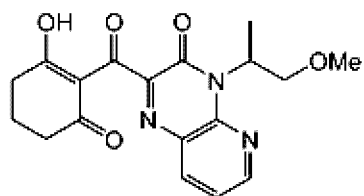
III-59



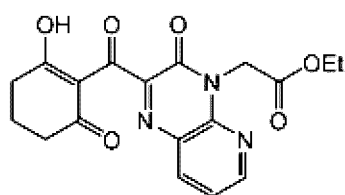
III-70



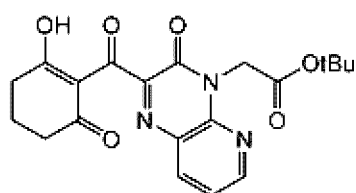
III-88



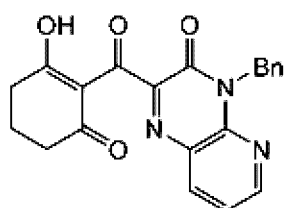
III-90



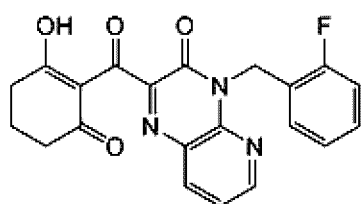
III-96



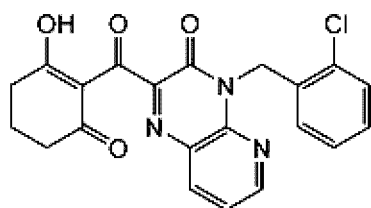
III-99



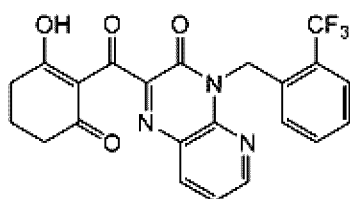
III-107



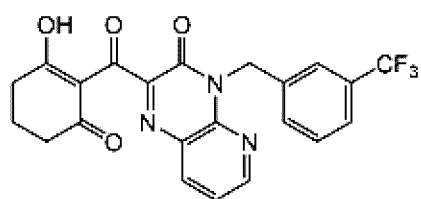
III-108



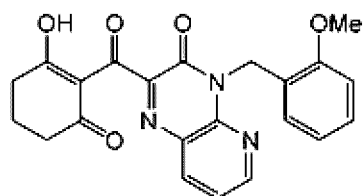
III-111



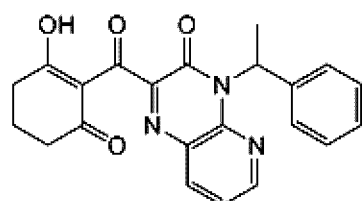
III-117



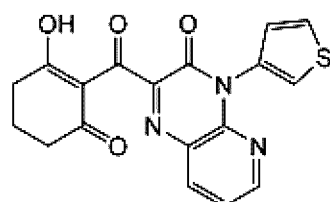
III-118



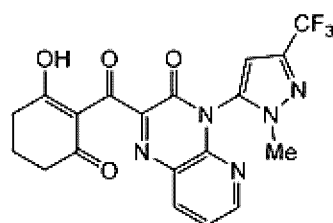
III-120



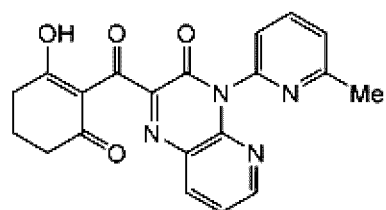
III-130



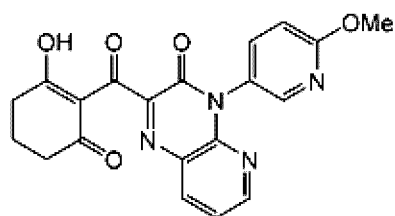
III-139



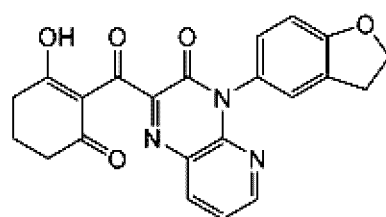
III-158



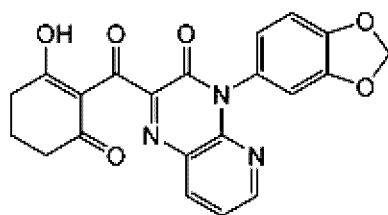
III-173



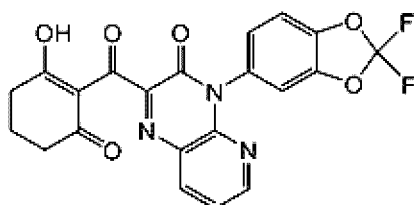
III-189



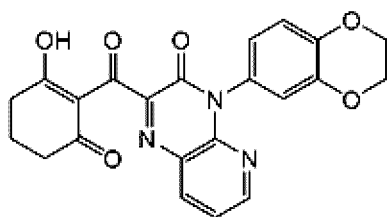
III-201



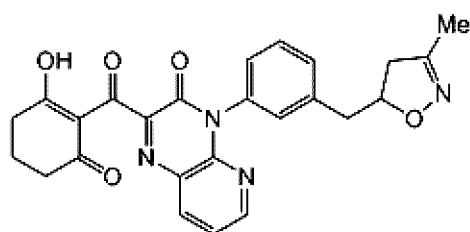
III-202



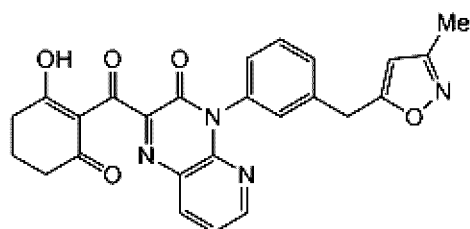
III-207



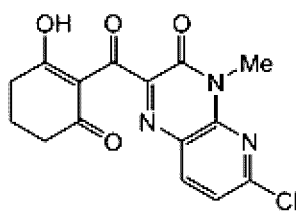
III-209



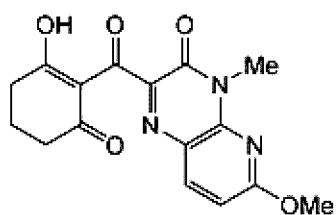
III-212



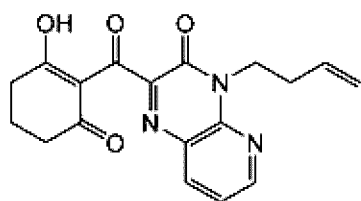
III-213



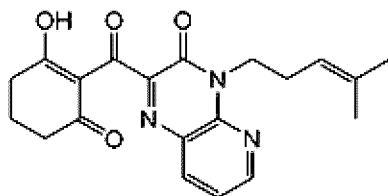
III-220



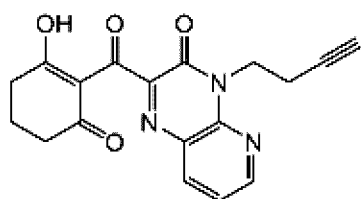
III-221



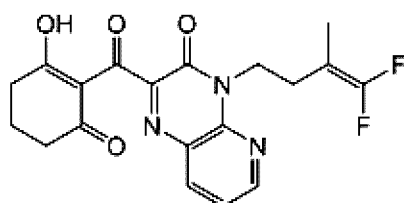
III-229



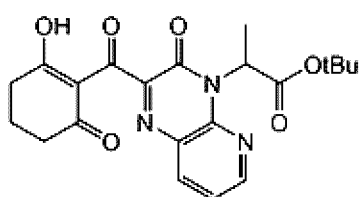
III-230



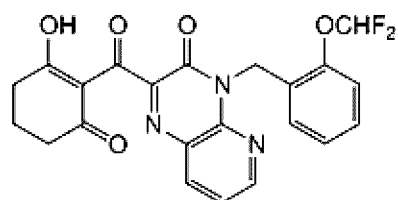
III-231



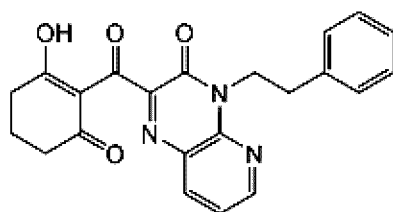
III-232



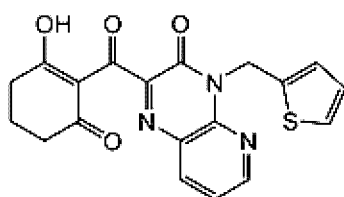
III-233



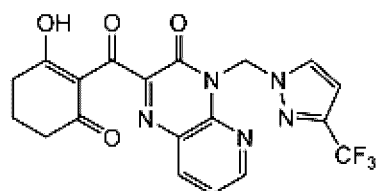
III-234



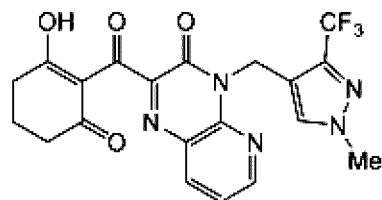
III-235



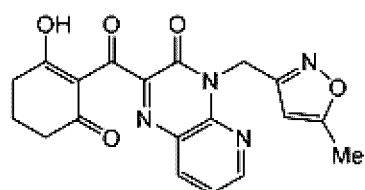
III-236



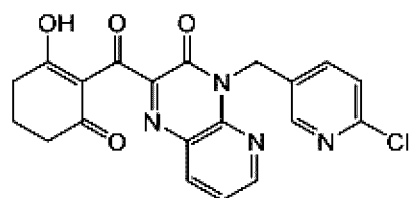
III-237



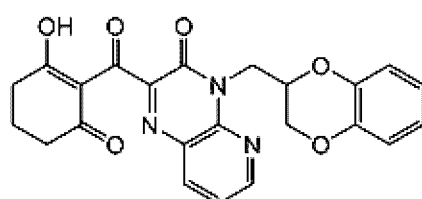
III-238



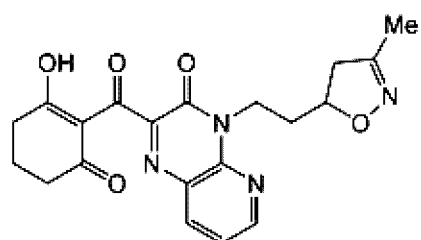
III-239



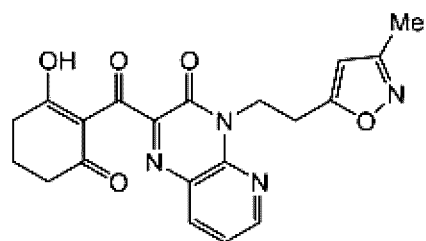
III-240



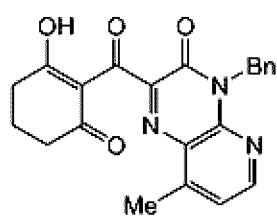
III-241



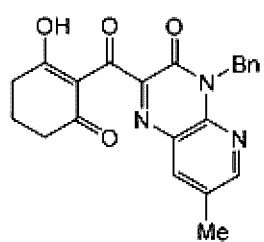
III-242



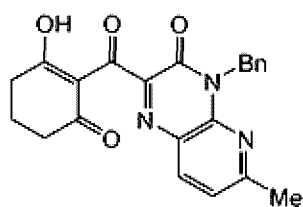
III-243



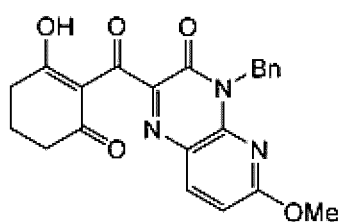
III-244



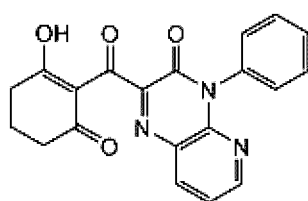
III-245



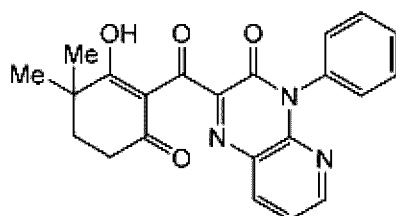
III-246



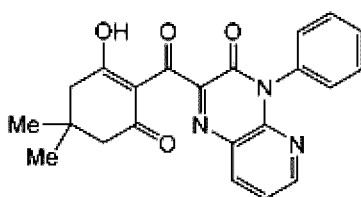
III-247



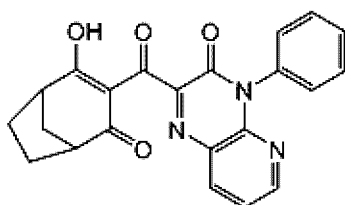
IV-1



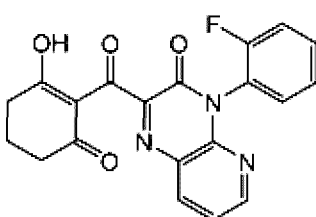
IV-2



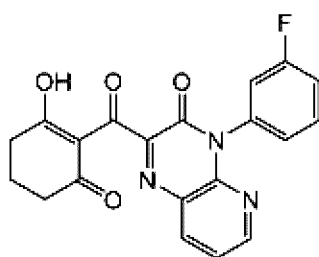
IV-3



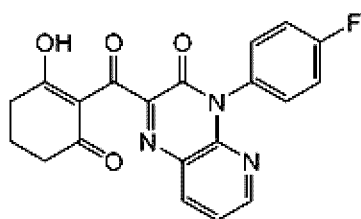
IV-4



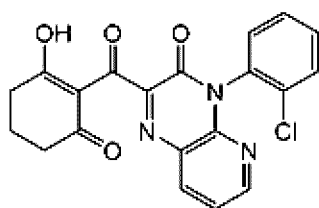
IV-6



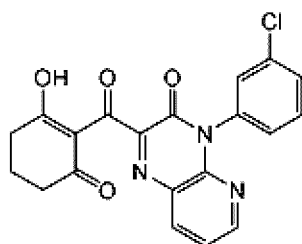
IV-7



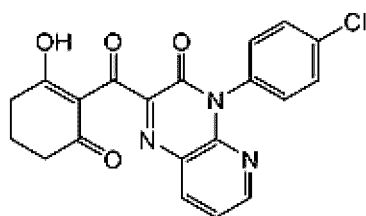
IV-8



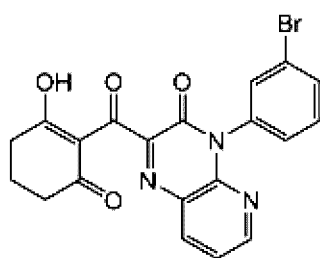
IV-9



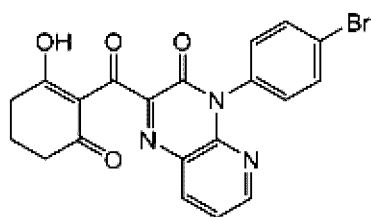
IV-11



IV-13

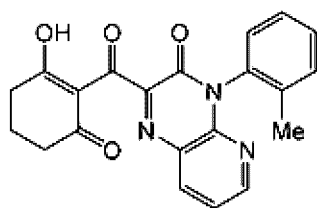


IV-17

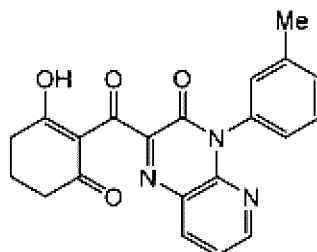


IV-18

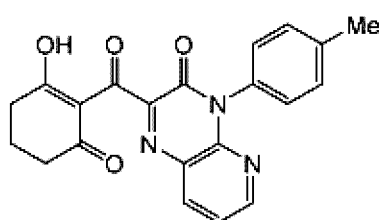
43



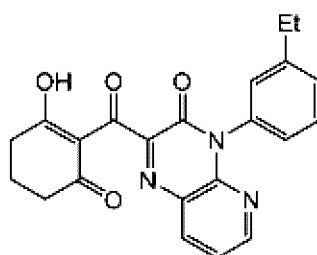
IV-19



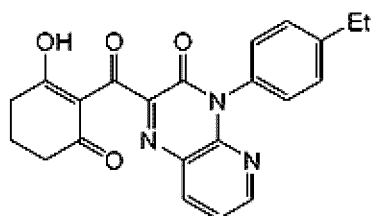
IV-20



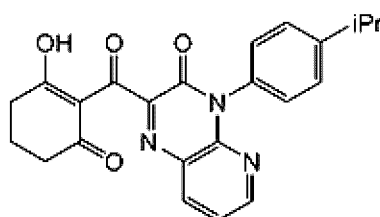
IV-21



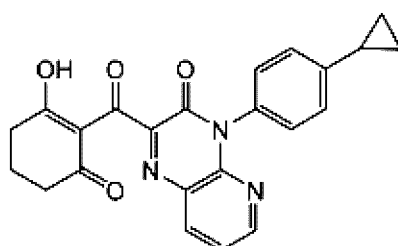
IV-23



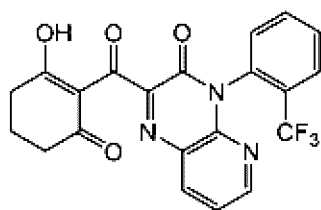
IV-24



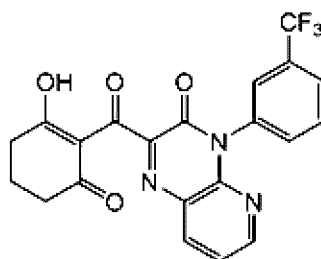
IV-30



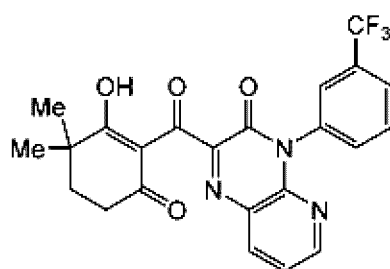
IV-33



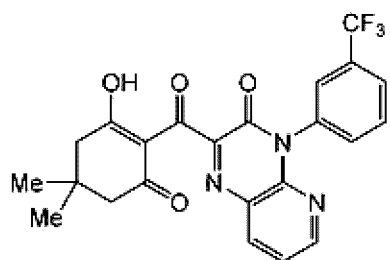
IV-34



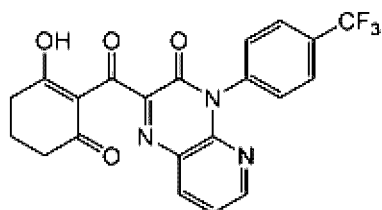
IV-39



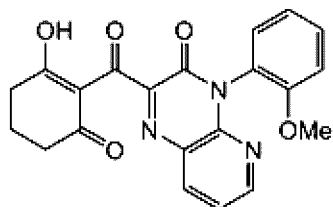
IV-40



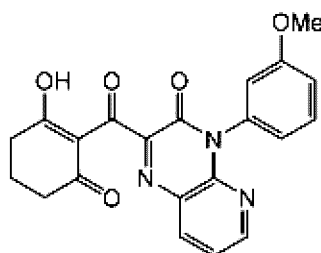
IV-41



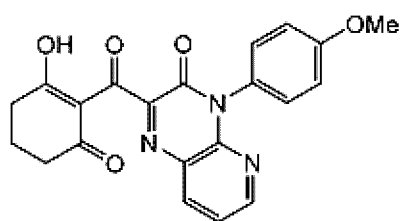
IV-44



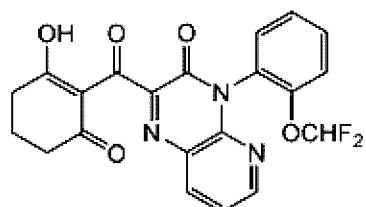
IV-52



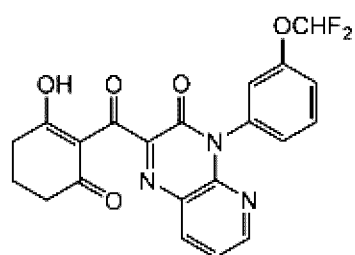
IV-57



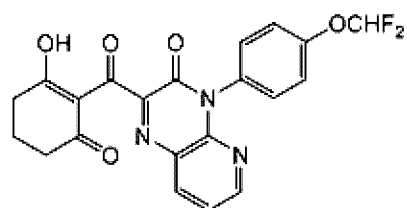
IV-62



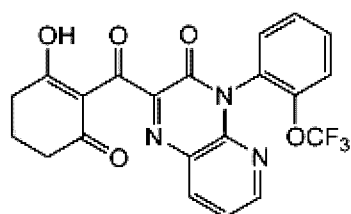
IV-85



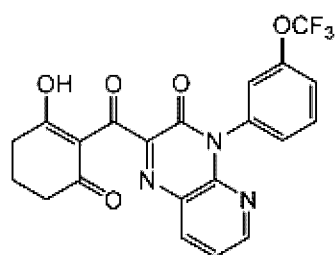
IV-90



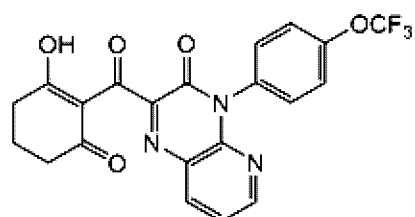
IV-95



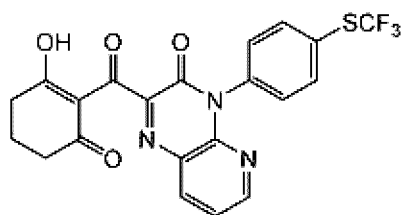
IV-100



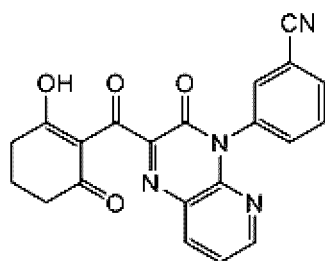
IV-101



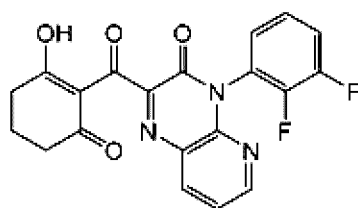
IV-106



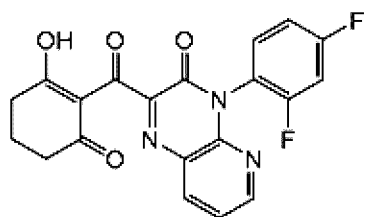
IV-128



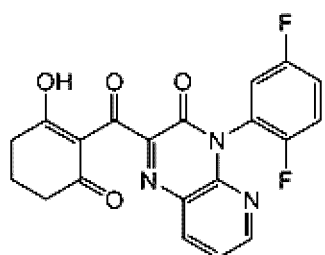
IV-136



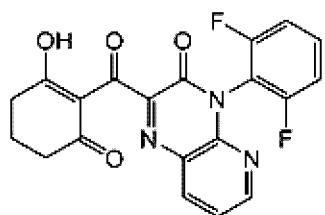
IV-150



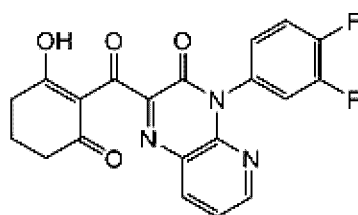
IV-151



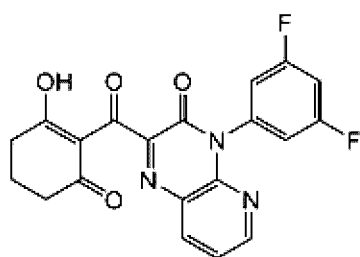
IV-152



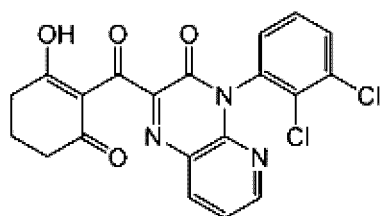
IV-153



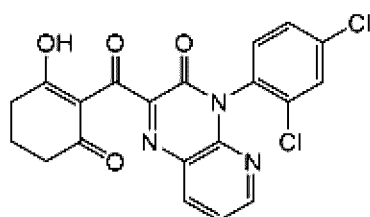
IV-154



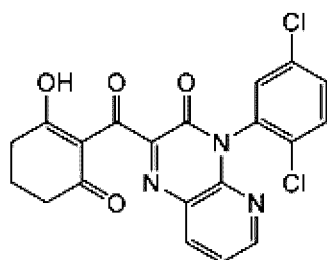
IV-155



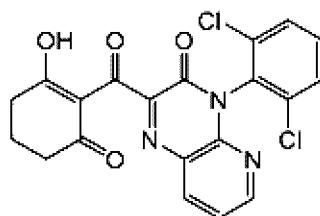
IV-156



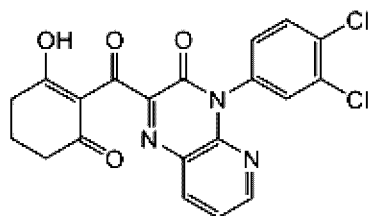
IV-157



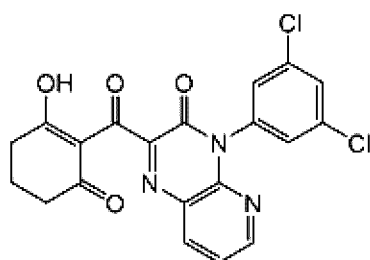
IV-158



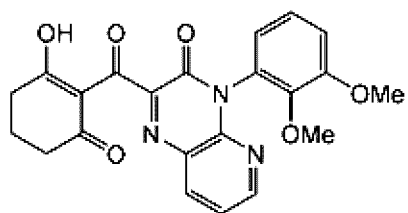
IV-159



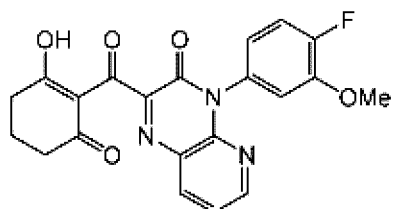
IV-160



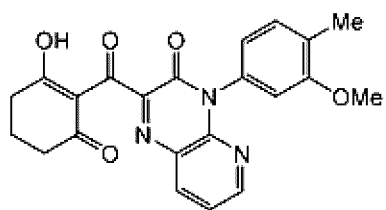
IV-161



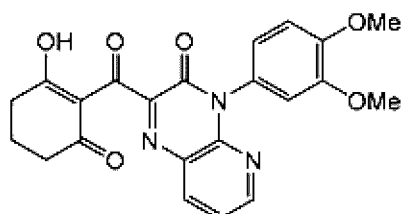
IV-165



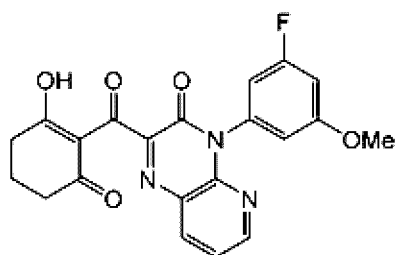
IV-166



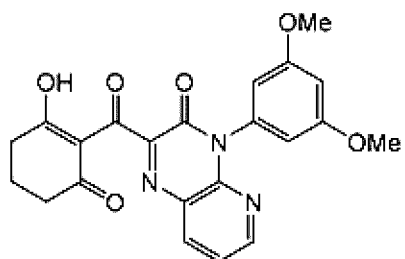
IV-168



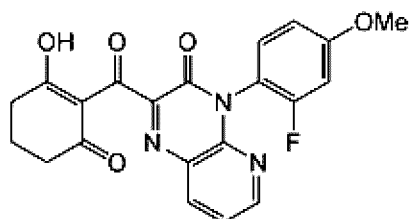
IV-169



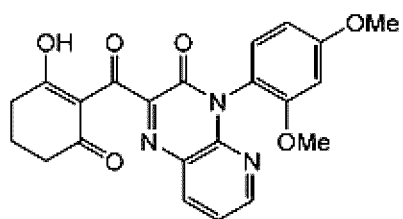
IV-170



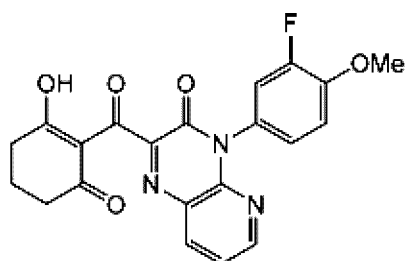
IV-173



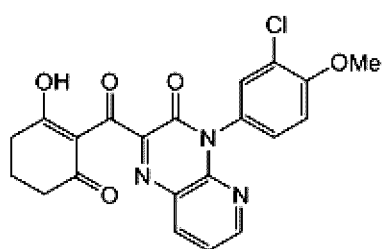
IV-174



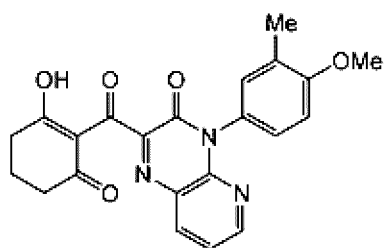
IV-177



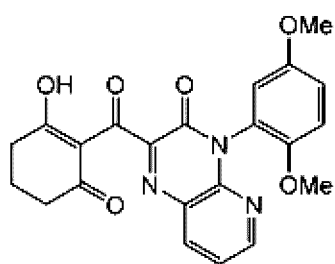
IV-178



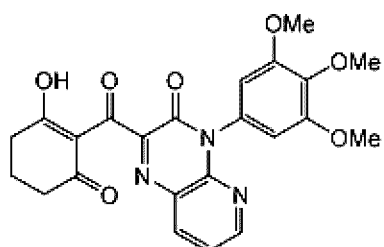
IV-179



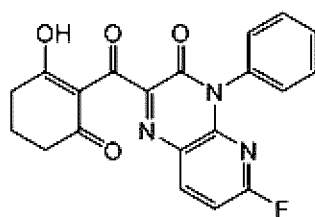
IV-180



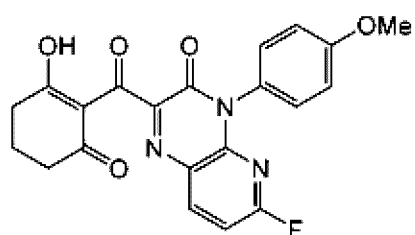
IV-184



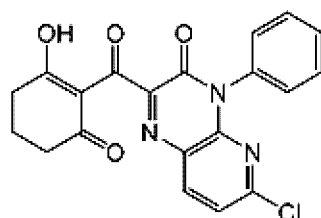
IV-185



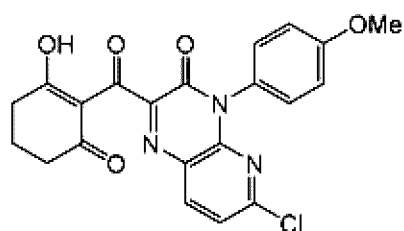
IV-186



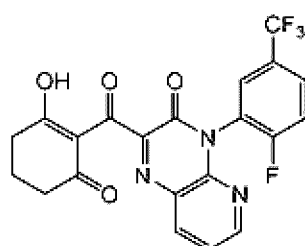
IV-187



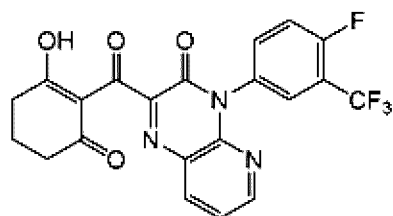
IV-188



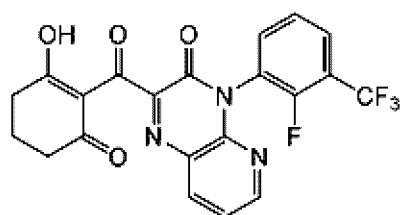
IV-189



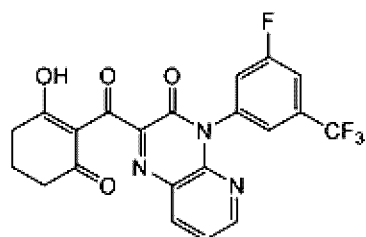
IV-200



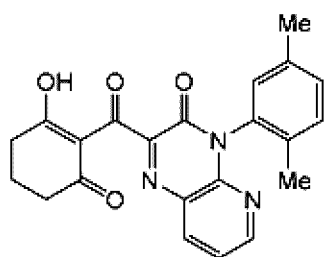
IV-201



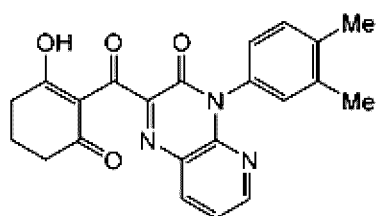
IV-202



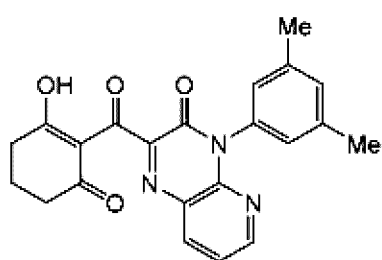
IV-203



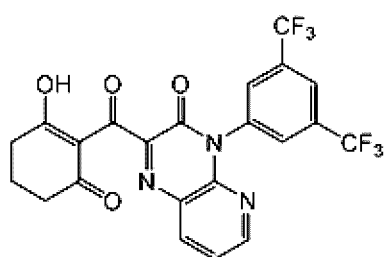
IV-206



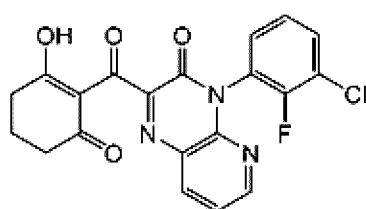
IV-208



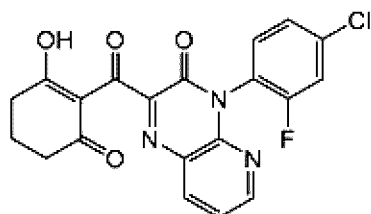
IV-209



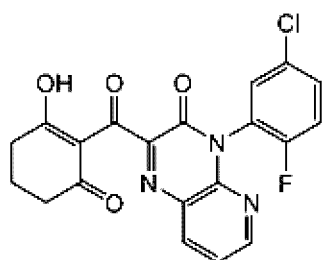
IV-210



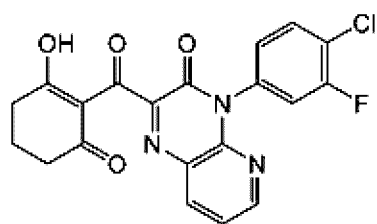
IV-212



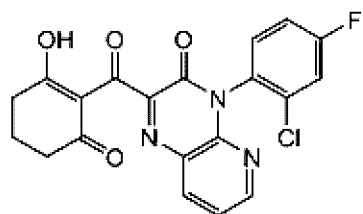
IV-213



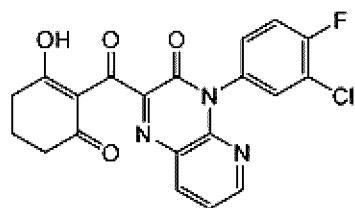
IV-214



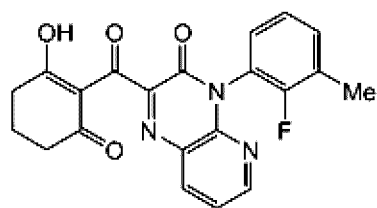
IV-215



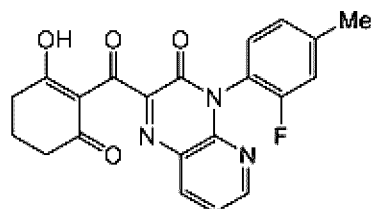
IV-216



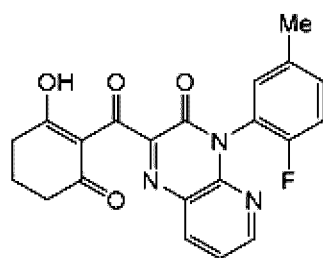
IV-217



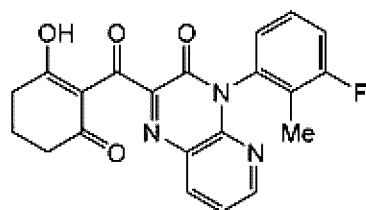
IV-218



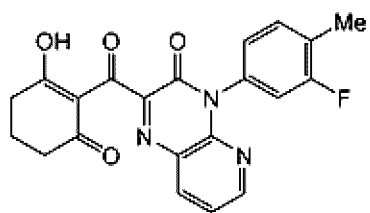
IV-219



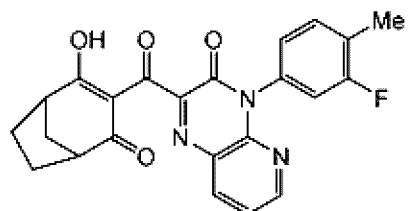
IV-220



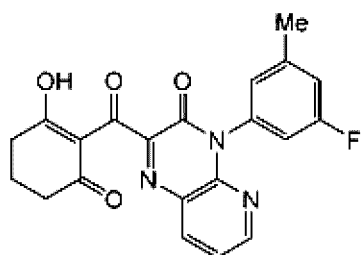
IV-221



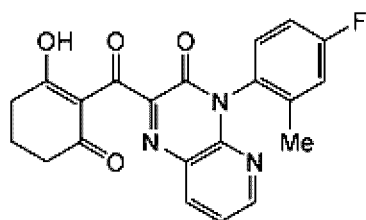
IV-222



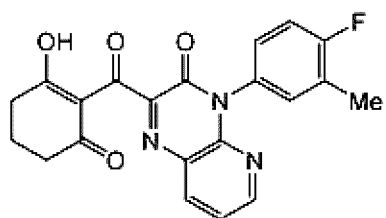
IV-223



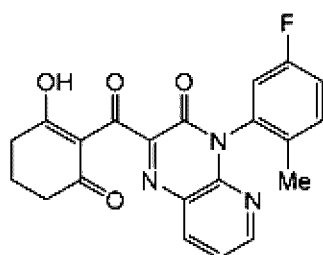
IV-224



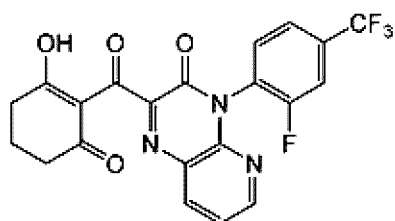
IV-225



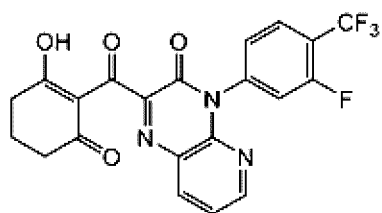
IV-226



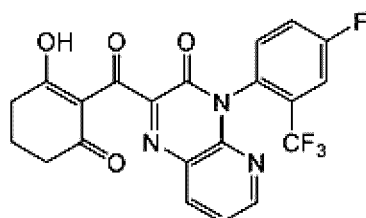
IV-227



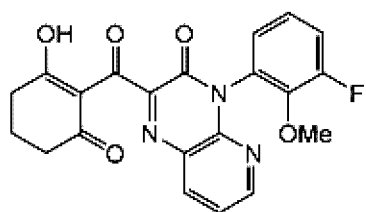
IV-228



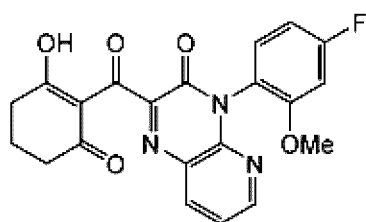
IV-229



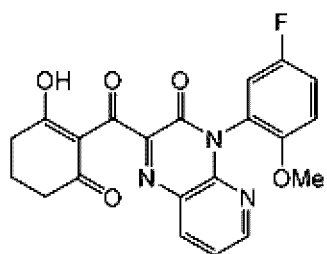
IV-230



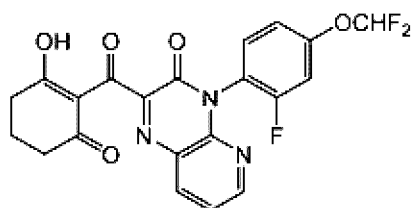
IV-231



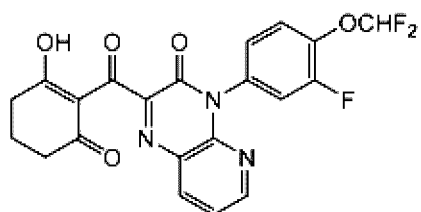
IV-232



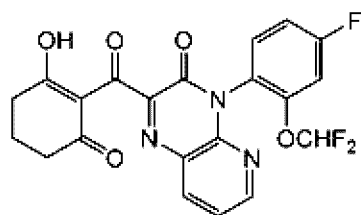
IV-233



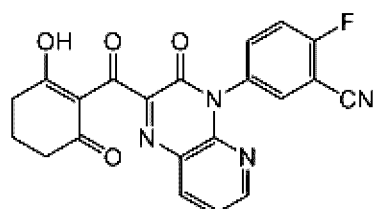
IV-234



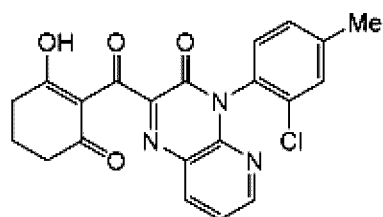
IV-235



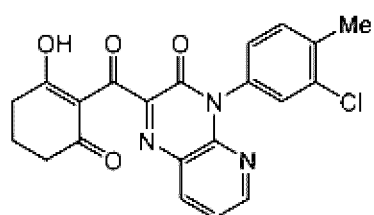
IV-236



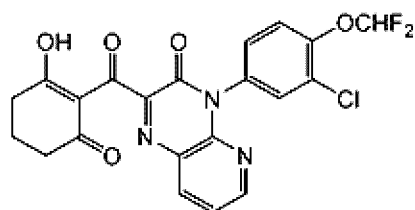
IV-237



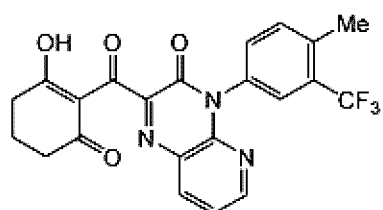
IV-238



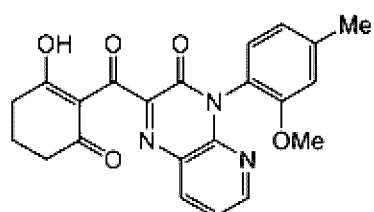
IV-239



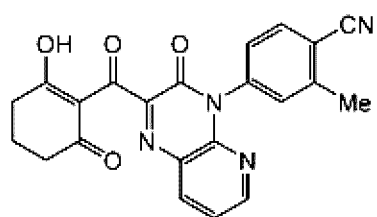
IV-240



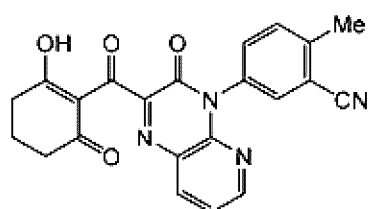
IV-241



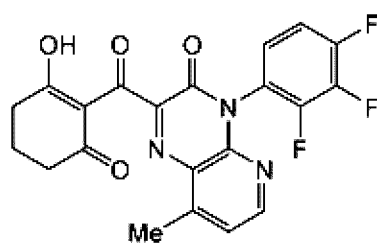
IV-242



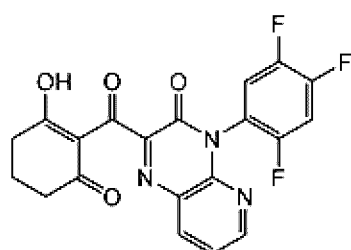
IV-243



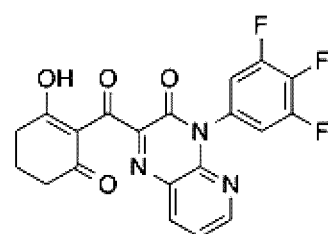
IV-244



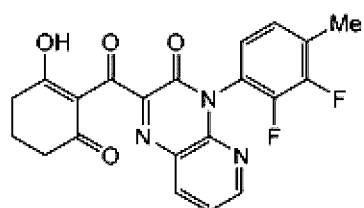
IV-245



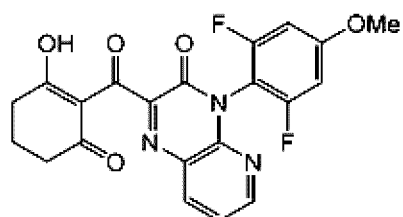
IV-247



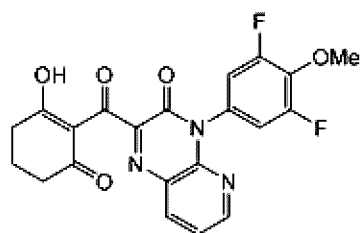
IV-248



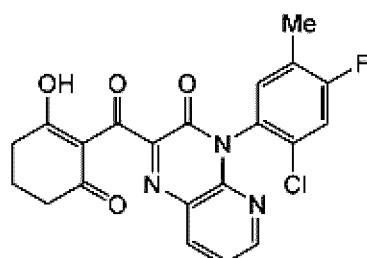
IV-249



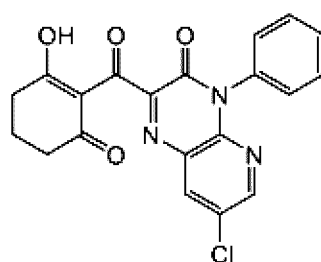
IV-250



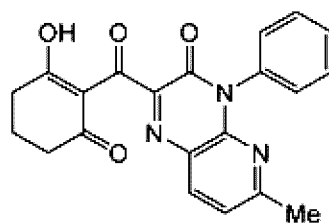
IV-251



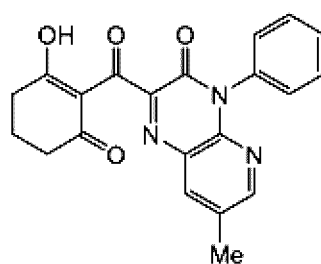
IV-252



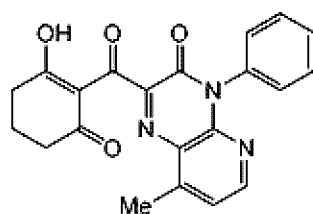
IV-253



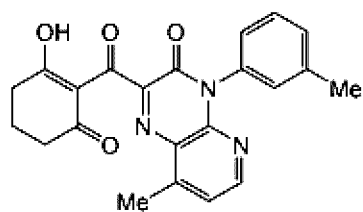
IV-254



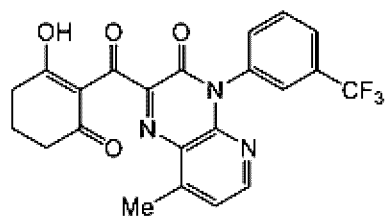
IV-255



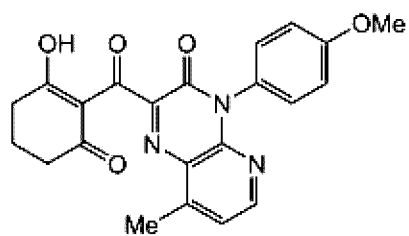
IV-256



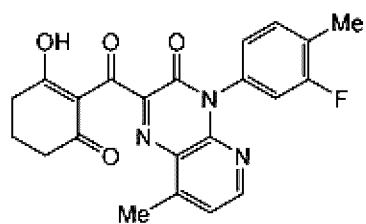
IV-257



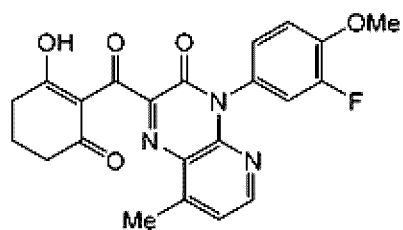
IV-258



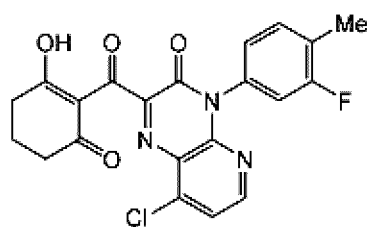
IV-259



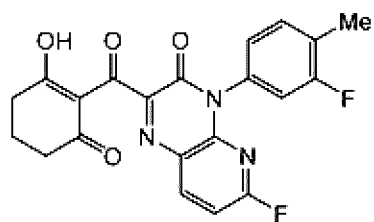
IV-260



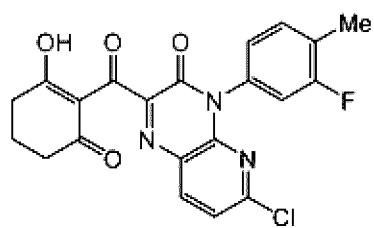
IV-262



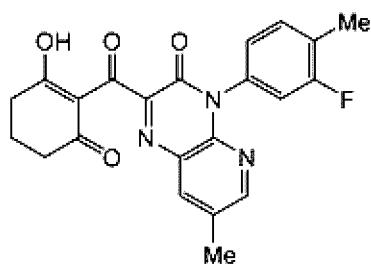
IV-265



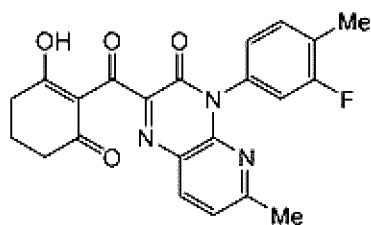
IV-266



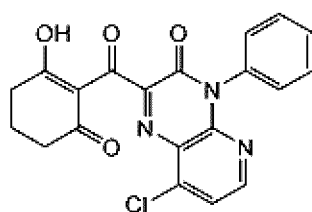
IV-267



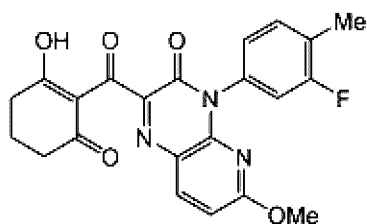
IV-268



IV-269



IV-270



IV-271,

5 ou um sal agroquimicamente aceitável do mesmo.

2. Herbicida, caracterizado pelo fato de que compreende o derivado de oxopirazina como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 7 ou um sal do mesmo, como um ingrediente ativo.

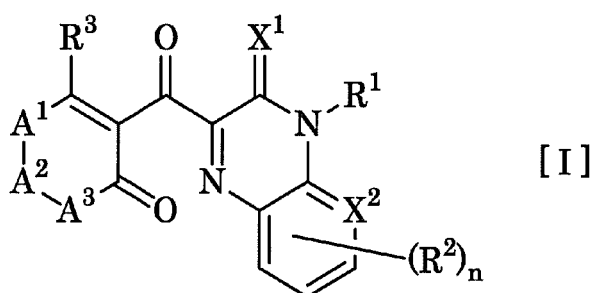
10 3. Método para usar um herbicida, caracterizado pelo fato de que o método compreende tratar solo e/ou plantas com uma quantidade efetiva do herbicida como definido na reivindicação 12.

RESUMO

“DERIVADO DE OXOPIRAZINA OU UM SAL AGROQUIMICAMENTE ACEITÁVEL DO MESMO, HERBICIDA, E, MÉTODO PARA USAR UM HERBICIDA”

5 A presente invenção fornece um derivado de oxopirazina tendo uma excelente atividade herbicida e, além disso, que apresenta alta segurança para lavouras úteis e similares, ou um sal do mesmo, e um herbicida contendo o mesmo.

10 A presente invenção diz respeito a um derivado de oxopirazina representado pela fórmula [I]:
[Fórmula química 39]



em que X¹ representa um átomo de oxigênio ou um átomo de enxofre; X² representa CH ou N(O)_m; m representa um número inteiro de 0 ou 1; R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C₁-C₁₂ e similares; R² representa um átomo de halogênio, um ciano grupo e similares; R³ é um grupo hidroxila, um átomo de halogênio e similares; A¹ representa C(R⁴R⁵); A² representa C(R⁶R⁷) ou C=O; A³ representa C(R⁸R⁹); R⁴ a R⁹ representam um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila,
ou um sal do mesmo, e um herbicida contendo estes compostos.